# This Page Is Inserted by IFW Operations and is not a part of the Official Record

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representation of The original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

## IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning documents will not correct images, please do not report the images to the Image Problem Mailbox.



① Veröffentlichungsnummer: 0 447 891 A1

(2)

## EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(2) Anmeldenummer: 91103547.5

(5) Int. Cl.5: C07D 495/04, A01N 49/00

(2) Anmeldetag: 08.03.91

Priorität: 19.03.90 DE 4008726

Veröffentlichungstag der Anmeldung: 25.09.91 Patentblatt 91/39

Benannte Vertragsstaaten: BE CH DE DK ES FR GB IT LI NL

(7) Anmelder: BASF Aktiengesellschaft Carl-Bosch-Strasse 38 W-6700 Ludwigshafen(DE)

(72) Erfinder: Wiesenfeldt, Matthias, Dr. Rosenstrasse 10

W-6704 Mutterstadt(DE)

Erfinder: Etzbach, Karl-Heinz, Dr.

Carl-Bosch-Ring 55

W-6710 Frankenthal(DE) Erfinder: Hofmeister, Peter, Dr.

Barnard-Humblot-Strasse 12

W-6730 Neustadt(DE)

Erfinder: Kuenast, Christoph, Dr.

Salierstrasse 2

W-6701 Otterstadt(DE)

Erfinder: Westphalen, Karl-Otto, Dr.

Mausbergstrasse 58 W-6720 Speyer(DE)

- Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate.
- Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate der allgemeinen Formeln I

in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

- Wasserstoff, C1-C5-Alkyl, C1-C3-Chloralkyl, C3-C6-Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyl
- Fluor, Chlor, Brom Jod, Hydroxy, Azido, Cyano, Thiocyanato, Mercapto, ein nicht über Stickstoff  $R^2$ gebundener organischer Rest oder ein Rest NR5R6, worin R5 und R6 unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino oder organische Reste bedeuten oder gemeinsam mit dem Stickstoffatom einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 8 Ringatomen bilden, mit der Maßgabe, daß R2 nicht Phenoxy-C2-C3alkylamino bedeutet,
- Chlor, Bromm Hydroxy oder Mercapto, mit der Maßgabe, daß nicht gleichzeitig R2 Hydroxy und R3  $R^3$ Brom bedeutet und daß nicht gleichzeitig R³ Hydroxy und R⁴ Alkoxycarbonyl oder Carboxy bedeutet,
- Wasserstoff, C1-C6-Alkyl, C3-C6-Mono-, Di- oder Trihalogenalkyl, Phenyl, Cyano, Formyl, Hydroxyimi-R<sup>4</sup> nomethyl, Carboxy, Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl oder einen Rest der Formel

CH=X

worin X der über Stickstoff gebundene Rest eines primären Amins oder der über der Kohlenstoff gebundene Rest iner methylenaktiven Verbindung ist,

sowie die Tautomeren dieser Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate und die nutzpflanzenverträglichen Salze dieser Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate und ihrer Tautomeren.

Di Verbindungen I finden als Insektizid , Wachstumsregulatoren und Herbizide Verwendung.

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate der allgemeinen Formel I

in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

- R¹ Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Chloralkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyl
- R<sup>2</sup> Fluor, Chlor, Brom, Jod, Hydroxy, Azido, Cyano, Thiocyanato, Mercapto, ein nicht über Stickstoff gebundener organischer Rest oder ein Rest NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, worin R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino oder organische Reste bedeuten oder gemeinsam mit dem Stickstoffatom einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 8 Ringatomen bilden, mit der Maßgabe, daß R<sup>2</sup> nicht Phenoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-alkylamino bedeutet,
- R³ Chlor, Brom, Hydroxy oder Mercapto mit der Maßgabe, daß nicht gleichzeitig R² Hydroxy und R³ Brom bedeutet und daß nicht gleichzeitig R³ Hydroxy und R⁴ Alkoxycarbonyl oder Carboxy bedeutet.
- R<sup>4</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Mono-, Di- oder Trihalogenalkyl, Phenyl, Cyano, Formyl, Hydroxyiminomethyl, Carboxy, Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl oder ein Rest der Formel

CH=X

5

10

15

25

55

worin X der über Stickstoff gebundene Rest eines primären Amins oder über der Kohlenstoff gebundene Rest einer methylenaktiven Verbindung ist,

sowie die Tautomeren dieser Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate und die nutzpflanzenverträglichen Salze dieser Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate und ihrer Tautomeren.

Außerdem betrifft die Erfindung die Herstellung der Verbindungen I, Mittel zur Bekämpfung von Schadpflanzen und Schadinsekten sowie zur Regulierung des Wachstums von Nutzpflanzen, die Verbindungen I als Wirkstoffe enthalten, sowie die Verwendung der Verbindungen I als Herbizide, Schädlingsbekämpfungsmittel oder Wachstumsregulatoren.

In der DE-A-26 54 090 und der US-A 4,196,207 sind Thieno[2,3-d]-pyrimidinderivate mit fungiziden, bakteriziden, antiviralen, wachstumsregulierenden und insektiziden bzw. akariziden Eigenschaften beschrieben, die in 5-Position auch halogensubstituiert sein können. In der Beschreibung und in den Beispielen werden jedoch nur Wasserstoff und Methyl als Substituenten in der 5-Position genannt. Die Wirksamkeit dieser Substanzen als Herbizide, Schädlingsbekämpfungsmittel und wachstumsregulierende Mittel ist unbefriedigend. Weiterhin sind aus den Arbeiten von M.M. Robba et al. (C.R. Acad. Sc. Paris (1968), 267, 697-700) und N.V. Kaplina et al. (Pharm. Chem. Journal (1987), 21 (2) 126-129) Thieno(2,3-d)-pyrimidinderivate bekannt, in denen in 4-Stellung Hydroxy und in 5-Stellung Brom steht. Kaplina et al. haben diese Verbindungen auf antivirale Aktivität untersucht. Ferner haben S. Kohra et al. (J.Het. Chem., (1988), 25, 959-968) das 4,5-Dihydroxy-6-methoxycarbonyl-2-phenyl-thieno[2,3-d]pyrimidin beschrieben. Eine Methode zur Herstellung von 4-Oxo-, 4-Thio- oder 4-Imino-thieno[2,3-d]pyrimidinen wird in der IN-151 496 beansprucht.

Der Erfindung lag die Aufgabe zugrunde, neue Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate mit herbiziden und verbesserten wachstumsregulierenden sowie verbesserten insektiziden Wirkungen bereitzustellen.

Demgemäß wurden die eingangs definierten Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate I gefunden. Die Verbindungen I weisen bemerkenswerte insektizide, herbizide und wachstumsregulierende Eigenschaften auf.

Die Verbindungen I, in denen R<sup>2</sup> und/oder R<sup>3</sup> für die Hydroxy oder die Mercaptogruppe stehen, bilden Keto-Enol-Tautomere. Beide Formen gehören ebenso zu den Verbindungen nach der Erfindung wie die pflanzenverträglichen Salze, z.B. von Mineralsäuren, wie Salzsäure, Schwefelsäure oder Phosphorsäure, oder von organischen Säuren, wie Essigsäure, Malonsäure, Bernsteinsäure oder Fumarsäure.

Unter den Verbindungen I sind diejenigen bevorzugt, in denen die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

- R¹ Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Chloralkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyl
- R<sup>2</sup> Hydroxy, Fluor, Chlor, Brom, Azido, Cyano, Thiocyanato, C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, Phenoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>-Cycloalkoxy, Hydroxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, Chlor-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkoxy, Phenyloxy oder Benzyloxy, Phenylethoxy, Amino-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, Bis(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)amino-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, Hydr xy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylamino-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, Mercapto, C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>-

Alkylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinylthio, Hydroxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkylthio, Bis- $C_1-C_3$ -alkylamino- $C_2-C_6$ -alkylthio, Carboxy- $C_1-C_4$ -alkylthio,  $C_1-C_3$ -Alkoxycarbonyl- $C_1-C_2$ -alkylthio, Furylmethylthio, Phenylthio oder Benzylthio, C1-C4-Alkoxycarbonylmethyl, Carboxym thyl, Bis- $(C_1-C_4-alkoxycarbonyl)$ methyl,  $\alpha-C_1-C_4-alkoxycarbonyl-\alpha-cyanomethyl, Dicyanomethyl,$ (carboxy)methyl, α-Cyano-α-phenyl-methyl, Pyrrolidino, Piperidino, Morpholino, Hexamethylenimino, N-Methylpiperazino, N-Ethylpiperazino, Imidazolyl, Pyrazolyl, Triazolyl, Tetrazolyl, Thiomorpholino, Hydrazino, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkylhydrazino, Bis-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl)hydrazino, Phenylhydrazino, Hydroxylamino, Morpholin-(1)-yl-amino, Hexamethylenimino-(1)-yl-amino, einen Rest NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, worin R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>20</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Hydroxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, Amino-C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>-alkyl, Bis-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>alkylamino-C2-C6-alkyl, Piperazin-(1)-yl-C2-C4-alkyl, Morpholin-(1)-yl-C2-C4-alkyl, C1-C3-Alkoxy-C 1-C4-alkyl, Phenoxy-C4-C6-Alkyl, Benzyloxy-C2-C6-alkyl, Hydroxy-C2-C3-alkoxy-C2-C6-alkyl, Hydroxy-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkylamino-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Phenoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>alkoxy-C2-C4-alkyl, Bis-hydroxymethyl-C1-C3-alkyl, Cyano-C2-C10-alkyl, Carboxy-C2-C10-alkyl, C  $_1\text{-}C_3\text{-}Alkoxy-C_2-C_3alkoxy-C_2-C_3-alkoxy-C_2-C_3-alkyl, \ Phenyl- C_1-C_4-alkyl, \ C_3\text{-}C_{12}-Cycloal-alkyl, \ Phenyl- C_1-C_4-alkyl, \ C_3\text{-}C_1$ kyl, Pyridyl, Furyl, Thienyl, Methylpyridyl, Pyridylmethyl, Furylmethyl, Thienylmethyl oder Adamantyl stehen,

wobei, wenn R¹ und/oder R² Phenyl bedeuten oder enthalten, dieser Phenylrest bis zu 3 gleiche oder verschiedene Substituenten, wie  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy, Halogen, Nitro, Amino, Hydroxy, Hydroxy- $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, Cyano, Carboxy, Aminocarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxycarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -Acyloxy,  $C_2$ - $C_6$ -Acylamino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylamino,  $C_1$ - $C_3$ -Acyl, Carboxy- $C_1$ - $C_2$ -alkyl, Di- $C_1$ - $C_4$ -alkylamino sowie Trifluormethyl und insbesondere Fluor, Chlor, Brom, Jod, Methyl, Ethyl, Amino, Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, Acetylamino oder Acetyl tragen kann,

R3 Chlor, Brom oder Hydroxy

R<sup>4</sup> Wasserstoff, Methyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Mono- oder Dichloralkyl, Cyano, Carboxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl oder CH=X, worin X für C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-Alkylimino, Phenylimino, Carboxymethylen, α-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-α-carboxymethylen, α-Phenyl-α-carboxymethylen, Dicarboxymethylen, Cyanomethylen, α-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-α-cyanomethylen, α-Phenyl-α-cyanomethylen, Dicyanomethylen, Formylmethylen, α-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-α-formylmethylen, α-Phenyl-α-formylmethylen, Diformylmethylen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonylmethylen, α-Cyano-α-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonylmethylen oder α-Phenyl-α-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonylmethylen steht.

Für den erfindungsgemäßen Zweck bevorzugte Verbindungen sind in Tabelle 1 aufgeführt, wobei die Verbindungen 4,5-Dichloro-6-methyl- (Nr. 12), 4-n-Propylamino-5-chloro- (Nr. 144), 4-n-Butylamino-5-chloro- (Nr. 146), 4-sek.Butylamino-5-chloro- (Nr. 147), 4-n-Hexylamino-5-chloro- (Nr. 154), 4-n-Heptylamino-5-chloro- (Nr. 155), 4-n-Octylamino-5-chloro- (Nr. 156), 4-n-Nonylamino-5-chloro- (Nr. 157), 4-(2-Methyl-hept-6-ylamino)-5-chloro- (Nr. 168), 4-(1-Ethoxyprop-3-ylamino)-5-chloro- (Nr. 185), 4-Benzylamino-5-chloro- (Nr. 282), 4-(Prop-1-in-3-ylamino)-5-chloro- (Nr. 293) und 4-(Hept-6-ylamino)-5-chloro-thieno[2,3-d]pyrimidin (Nr. 395) besonders bevorzugt sind.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen I können z.B. hergestellt werden, indem man Thiophenderivate der allgemeinen Formel II

$$\begin{array}{c|c}
R^3 & CN \\
R^4 & S & NH_2
\end{array}$$

mit einem Dialkylamid III

$$\begin{array}{c}
0 \\
 \searrow -N \\
 \uparrow \uparrow 2
\end{array}$$
(III)

in dem T<sup>1</sup> und T<sup>2</sup> unabhängig voneinander für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder zusammen mit dem Amidstickstoff für einen 5 bis 7 gliedrigen gesättigten Heterocyclus stehen, in Gegenwart von 2 bis 20 mol Phosphorylchlorid oder Phosphorylbromid, bezogen auf 1 mol II, zu Thieno(2,3-d)pyrimidinderivaten d r allg m inen Formel la

50

5

10

15

20

25

VI

5

15

in der R<sup>7</sup> für Chlor oder Brom steht, umsetzt und in diesen gegebenenfalls R<sup>7</sup> in an sich üblicher Weise gegen andere Nucleophile Reste R<sup>2</sup> austauscht.

Geeignete Dialkylamide III sind zum Beispiel N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N,N-Diethylformamid, N,N-Diethylacetamid, N,N-Dimethylpropionamid und N,N-Dimethylbenzoesäureamid.

Wichtig für das erfindungsgemäße Verfahren ist die Verwendung eines Überschusses von Phosphorylchlorid bzw. Phosphorylbromid bezogen auf das eingesetzte Thiophenderivat II. Es kann auch vorteilhaft sein, die Reaktion in dem geeigneten Phosphorylhalogenid als Lösungsmittel durchzuführen. Man verwendet bevorzugt 2 bis 6 mol Phosphorylhalogenid pro Mol II.

Das Molverhältnis von Thiophenderivat II zu N,N-Dialkylamid III beträgt in der Regel 1:1 bis 1:5.

Zweckmäßig wird die Reaktion in einem inerten Lösungsmittel, wie Chlorbenzol, Nitrobenzol, Benzoe-säuremethylester, Methylenchlorid, Dichlorbenzol, Trichlorbenzol, Benzoesäureethylester, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, eines der oben beschriebenen N,N-Dialkylamide, Trichlorethan, Hexamethylphosphorsäuretriamid (HMPT) oder Tetrachlorethylen, durchgeführt. Bevorzugte Lösungsmittel sind Phosphorylchlorid, Phosphorylbromid oder eines der oben beschriebenen N,N-Dialkylamide.

Die Reaktion verläuft ab etwa 20°C mit ausreichender Geschwindigkeit. Bei Temperaturen von über 150°C sinkt die Spezifität der Reaktion. Vorzugsweise führt man die Reaktion in einem Temperaturbereich von 50 bis 110°C durch.

Die Verwendung von katalytischen Mengen einer Lewis Säure, wie Kaliumchlorid, Natriumchlorid, Eisen-(III)-chlorid, Aluminiumchlorid, Zinkchlorid, Zinnchlorid, Antimonpentafluorid, Bortrichlorid, Titantetrachlorid, oder eines basischen Katalysators wie N,N-Dimethylanilin oder N,N-Diethylanilin, kann zu einer Steigerung der Reaktionsgeschwindigkeit und einer Erhöhung der Ausbeute führen.

Die so erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel la kann man nach bekannten Methoden (The Chemistry of Heterocyclic Compounds, "The pyrimidines", ed. D. J. Brown, J. Wiley & Sons, New York, London, Vol. 16, (1962); Vol. 16, Suppl. 1, (1970); Vol. 16, Suppl. 2 (1985)) durch den Austausch des Halogenatoms in Position 4 gegen andere nucleophile Reste R<sup>2</sup> in die korrespondierenden Verbindungen I umwandeln.

Ein weiteres Verfahren zur Herstellung der Thienopyrimidinderivate der allgemeinen Formel I nach Anspruch 1, ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der allgemeinen Formel IV

35

$$\begin{array}{c|c}
R^3 & NH_2 \\
R^4 & S & NH_2
\end{array}$$
(IV)

40

in der die Substituenten R³ und R⁴ die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben, in an sich üblicher Weise mit einem Säureanhydrid, das mindestens einen Rest R¹-CO- enthält, oder einer Carbonsäure R¹-COOH, oder einem Addukt aus einer Carbonsäure R¹-COOH und einer Lewissäure, wobei R¹ jeweils die angegebene Bedeutung hat, zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ib

umsetzt, diese mit einem Phosphorylhalogenid in Verbindungen der allgemeinen Formel la gemäß Anspruch 2 überführt und in diesen geg benenfalls R<sup>7</sup> in an sich üblicher Weise gegen andere nucleophil Reste R<sup>2</sup> austauscht.

In bestimmten Fällen ist es zweckmäßig, di Ums tzung von IV zu Ib in zwei Schritten durchzuführen, d.h. die als Zwischenprodukt auftretenden V rbindung in der allgemeinen Form I VI

zu isolieren.

5

10

15

50

In der Regel setzt man das Säureanhydrid oder das Addukt in Mengen von 100 bis 500 mol-%, bevorzugt 100 bis 300 mol-%, bezogen auf die Verbindungen IV, ein.

Die Carbonsäureanhydride, die mindestens einen Rest R¹-CO- enthalten, können aus zwei Carbonsäuren R¹-COOH, wie Pivalinsäure, Propionsäure oder Essigsäure; oder aus einer Carbonsäure R¹-COOH und einer Oxosäure, wie Phosphorsäure oder Schwefelsäure, aufgebaut sein.

Bevorzugte Carbonsäuren R¹-COOH sind solche mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, insbesondere Ameisensäure und Essigsäure.

Außerdem kommen auch Addukte aus einer Carbonsäure R¹-COOH und einer Lewissäure, wie Zinkchlorid, Bortrifluorid oder Titantetrachlorid, in Betracht.

Die Umsetzung von IV zu Ib erfolgt vorteilhaft in inerten Lösungsmitteln, wie N,N-Dialkylamiden, von denen N,N-Dimethylformamid und Dimethylacetamid besonders bevorzugt sind, N-Methylpyrrolidon, N,N-Dimethylpropylenhamstoff oder Hexamethylphosphorsäuretriamid, bei Temperaturen von (-10) bis 150°C, vorzugsweise 20 bis 120°C, insbesondere 80 bis 120°C.

Für den Fall, daß man die intermediär auftretenden Verbindungen VI isolieren will, wählt man vorzugsweise Reaktionstemperaturen zwischen (-10) und 80 °C.

In der Regel gibt man eine Base wie Triethylamin, N-Methylpyrrolidon oder N,N-Dimethylanilin, in einem 1- bis 10-fachen Überschuß, bevorzugt 1- bis 5-fachen Überschuß zu, bezogen auf das Carbonsäure-anhydrid, die Carbonsäure oder das Carbonsäure-Lewissäure-Addukt.

Der Zusatz eines wasserentziehenden Reagenzes, wie Dicyclohexylcarbodiimid, oder eines Vilsmeier-Reagenzes kann die Reaktion beschleunigen und die Ausbeute an Ib erhöhen.

Die Hydroxygruppe in 4-Stellung der Verbindungen Ib kann man anschließend nach an sich bekannten Methoden beispielsweise mit Phosphorylchlorid oder Phosphorylbromid gegen Chlor oder Brom austauschen.

Gegegenenfalls kann man das Chlor bzw. Brom in 4-Stellung nach an sich bekannten Methoden gegen andere nucleophile Reste R² substituieren.

Auch durch die Umsetzung der Verbindungen II mit Orthoestern (V) gemäß Anspruch 4 zu den Thiophenderivaten VI und anschließende Cyclisierung in Gegenwart eines geeigneten Nucleophils können die erfindungsgemäßen Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate I erhalten werden.

Die zuletzt beschriebene Reaktionsfolge ist an sich aus der DE-A 26 54 090 bekannt. Die Thiophenderivate II und IV kann man nach den in der EP-A1 0193 885 beschriebenen Vorschriften erhalten.

Zur Darstellung von pflanzenverträglichen Salzen kann man die Thieno(2,3-d)pyrimidinderivate I mit üblicherweise verwendeten Salzbildnern, wie Chlorwasserstoffsäure, Bromwasserstoffsäure, Jodwasserstoffsäure, Schwefelsäur , Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, Oxalsäure, Benzolsulfonsäure, p-Toluolsulfonsäure, Dodecylbenzolsulfonsäur , Methylbromid, Dim thylsulfat oder Diethylsulfat im Temperaturber ich von 0 bis 150°C, vorzugsweis 20 bis 120°C, umsetzen.

Die Salzbildung wird zweckmäßig rweise in ein m Lösungs- oder V rdünnungsmittel durchgeführt. Hi rzu eignen sich beispielsw is aliphatisch Kohlenwasserstoffe, wi n-Pentan, n-H xan oder P trolether,

aromatische Kohlenwasserstoff , wi Benzol, Toluol oder Xylole, Benzin oder Ether, wi Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan, ferner Ketone, wie Aceton, Methylethylketon oder Methylisopropylketon, sowie halogeniert Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol, Methylenchlorid, Ethylenchlorid, Chloroform und Tetrachlorethyl n. Auch Gemische dies r Lösungsmittel können v rwendet werden.

Zur Herstellung der Salze der Verbindungen I setzt man die Ausgangsstoffe üblicherweise in stöchiometrischem Verhältnis ein. Ein Überschuß der einen oder anderen Komponente kann von Vorteil sein.

Die erfindungsgemäßen Herbizide, Wachstumsregulatoren und Schädlingsbekämpfungsmittel können beispielsweise direkt versprühbare Lösungen, Pulver, Suspensionen, auch hochprozentige wäßrige, ölige oder sonstige Suspensionen, wäßrige oder ölige Dispersionen, Emulsionen, Pasten, Stäubemittel, Streumittel oder Granulate sein und durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall eine möglichst feine Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Als inerte Trägerstoffe kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron oder stark polare Lösungsmittel wie N,N-Dimethylformamid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Dispersionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Oberflächenaktive Stoffe erleichtern die feine Verteilung. Als solche kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutylnaphthalinsulfonsäure; Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphtalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Alkylarylpolyglykolether, wie ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Tributylphenylpolyglykolether, Fettalkoholethoxylate, wie Isotridecylethoxylat und wie ethoxyliertes Rizinusöl, Kondensationsprodukte aus Ethylenoxid und Propylenoxid, wie ethoxyliertes Polyoxypropylen, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten üblicherweise zwischen 0,01 und 99 Gew.%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 70 Gew.-%, Wirkstoff. Die Wirkstoffe werden zweckmäßig in einer Reinheit von 80 % bis 99,9 %, vorzugsweise 90 % bis 99 % (nach NMR-Spektrum) eingesetzt

Die erfindungsgemäßen Verbindungen I können beispielsweise wie folgt formuliert werden:

50

- I. Man vermischt 90 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 431 mit 10 Gewichtsteilen N-Methyl-α-pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist.
- II. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 154 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Xylol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- III. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 155 werden in einer Mischung gelöst, di aus 40 Gewichtst il n Cycloh xanon, 30 G wichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteil n des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylen xid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000

10

15

20

55

Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

IV. 20 Gewichtsteil des Wirkstoffs Nr. 168 w rden in iner Mischung gelöst, di aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteil n einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 G wichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Vert ilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser rhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

- V. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 385 werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-α-sulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- VI. 3 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 274 werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt oder vermahlen. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- VII. 30 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 281 werden mit einer Mischung aus 92 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gewichtsteilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt oder vermahlen. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit.
- VIII. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 292 werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkohol-polyglykolether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt oder vermahlen. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.

Die Applikation der herbiziden und wachstumsregulierenden Mittel bzw. der Wirkstoffe kann im Vorauflauf- oder im Nachauflaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

In Anbetracht der Vielseitigkeit der Applikationsmethoden können die erfindungsgemäßen Verbindungen bzw. sie enthaltende Mittel in einer großen Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden.

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die erfindungsgemäßen Verbindungen 1 mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner Diazine, 4H-3, 1-Benzoxazinderivate, Benzothiadiazinone, 2,6-Dinitroaniline, N-Phenylcarbamate, Thiolcarbamate, Halogencarbonsäuren, Triazine, Amide, Harnstoffe, Diphenylether, Triazinone, Uracile, Benzofuranderivate, Cyclohexan-1,3-dionderivate, Chinolincarbonsäurederivate, Aryloxy-, Heteroaryloxyphenoxypropionsäuren sowie deren Salze, Ester und Amide in Betracht.

Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen I allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

Die Aufwandmengen an Wirkstoff bei Anwendung als Herbizide betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 5, vorzugsweise 0,01 bis 3 kg/ha aktive Substanz.

Die Verbindungen der Formel I können praktisch alle Entwicklungsstadien einer Pflanze verschiedenartig beeinflussen und werden deshalb auch als Wachstumsregulatoren eingesetzt. Die Wirkungsvielfalt der Pflanzenwachstumsregulatoren hängt ab vor allem

- a) von der Pflanzenart und -sorte,
- b) von dem Zeitpunkt der Applikation, bezogen auf das Entwicklungsstadium der Pflanze, und von der Jahreszeit,
- c) von dem Applikationsort und -verfahren (Samenbeize, Bodenbehandlung, Blattapplikation oder Stamminjektion bei Bäumen)
- d) von klimatischen Faktoren, z.B. Temperatur, Niederschlagsmenge, außerdem auch Tageslänge und Lichtintensität
  - e) von der Bodenbeschaff nheit (einschließlich Düngung),
  - f) von der Formulierung bzw. Anwendungsform des Wirkstoffs und schließlich

g) von den angewend ten Konzentrationen der aktiven Substanz.

Die erfindungsgemäß zu verwendend n Wachstumsregulatoren der Formel I können den Kulturpflanzen sowohl vom Samen her (als Saatgutbeizmittel) als auch über den Boden, d.h. durch die Wurzel sowie - besonders bevorzugt - durch Spritzung über das Blatt zugeführt werden.

Infolge der hohen Pflanzenverträglichkeit kann die Aufwandmenge stark variiert werden.

Die Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate der Formel I sind auch geeignet, Schädlinge aus der Klasse der Insekten, Spinnentiere und Nematoden wirksam zu bekämpfen. Sie können im Pflanzenschutz sowie auf dem Hygiene-, Vorratsschutz- und Veterinärsektor als Schädlingsbekämpfungsmittel eingesetzt werden.

Zu den schädlichen Insekten gehören aus der Ordnung der Schmetterlinge (Lepidoptera) beispielsweise Agrotis ypsilon, Agrotis segetum, Alabama argillacea, Anticarsia gemmatalis, Argyresthia conjugella, Autographa gamma, Bupalus piniarius, Cacoecia murinana, Capua reticulana, Cheimatobia brumata, Choristoneura fumiferana, Choristoneura occidentalis, Cirphis unipuncta, Cydia pomonella, Dendrolimus pini, Diaphania nitidalis, Diatraea gradiosella, Earias insulana, Elasmopalpus lignosellus, Eupoecilia ambiguella, Evetria bouliana, Feltia subterranea, Galleria mellonella, Grapholita funebrana, Grapholita molesta, Heliothis armigera, Heliothis virescenis, Heliothis zea, Hellula undalis, Hibernia defoliaria, Hyphantria cunea, Hyponomeuta malinellus, Keifferia lycopersicella, Lambdina fiscellaria, Laphygma exigua, Leucoptera coffeella, Leucoptera scitella, Lithocolletis blancardella, Lobesia botrana, Loxostege sticticalis, Lymantria dispar, Lymantria monacha, Lyonetia clerkella, Malacosoma neustria, Mamestra brassicae, Orgyia pseudotsugata, Ostrinia nubilalis, Panolis flamea, Pectinophora gossypiella, Peridroma saucia, Phalera bucephala, Phthorimaea operculella, Phyllocnistis citrella, Pieris brassicae, Plathypena scarbra, Plutella xylostella, Pseudoplusia includens, Phyacionia frustrana, Scrobipalpula absoluta, Sitotroga cerelella, Sparganothis pilleriana, Spodoptera frugiperda, Spodoptera littoralis, Spodoptera litura, Thaumatopoea pityocampa, Tortrix viridana, Trichoplusia ni, Zeiraphera canadensis.

Aus der Ordnung der Käfer (Coleoptera) beispielsweise Agrilus sinuatus, Agriotes lineatus, Agriotes obscurus, Amphimallus solstitialis, Anisandrus dispar, Anthonomus grandis, Anthonomus pomorum, Atomaria linearis, Blastophagus piniperda, Blitophaga undata, Bruchus rufimanus, Bruchus pisorum, Bruchus lentis, Byctiscus betulae, Cassida nebulosa, Cerotoma trifurcata, Ceuthorrhynchus assimilis, Ceuthorrynchus napi, Chaetocnema tibialis, Conoderus vespertinus, Crioceris asparagi, Diabrotica longicomis, Diabrotica 12-punctata, Diabrotica virgifera, Epilachna varivestis, Epitrix hirtipennis, Eutinobothrus brasiliensis, Hylobius abietis, Hypera brunneipennis, Hypera postica, Ips typographus, Lema bilineata, Lema melanopus, Leptinotarsa decemlineata, Limonius californicus, Lissorhoptrus oryzophilus, Melanotus communis, Meligethes aeneus, Melolontha hippocastani, Melolontha melolontha, Onlema oryzae, Ortiorrhynchus sulcatus, Otiorrhynchus ovatus, Phaedon cochleariae, Phyllotreta chrysocephala, Phyllophaga sp., Phyllopertha horticola, Phyllotreta nemorum, Phyllotreta striolata, Popillia japonica, Sitona lineatus, Sitophilus granaria.

Aus der Ordnung der Zweiflügler (Diptera) beispielsweise Aedes aegypti, Aedes vexans, Anastrepha ludens, Anopheles maculipennis, Ceratitis capitata, Chrysomya bezziana, Chrysomya hominivorax, Chrysomya macellaria, Contarinia sorghicola, Cordylobia anthropophaga, Culex pipiens, Dacus cucurbitae, Dacus oleae, Dasineura brassicae, Fannia canicularis, Gasterophilus intestinalis, Glossia morsitans, Haematobia irritans, Haplodiplosis equestris, Hylemyia platura, Hypoderma lineata, Liriomyza sativae, Liriomyza trifolii, Lucilia caprina, Lucilia cuprina, Lucilia sericata, Lycoria pectoralis, Mayetiola destructor, Musca domestica, Muscina stabulans, Oestrus ovis, Oscinella frit, Pegomya hysocyami, Phorbia antiqua, Phorbia brassicae, Phorbia coarctata, Rhagoletis cerasi, Rhagoletis pomonella, Tabanus bovinus, Tipula oleracea, Tipula paludosa.

Aus der Ordnung der Thripse (Thysanoptera) beispielsweise Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella tritici, Scirtothrips citri, Thrips oryzae, Thrips palmi, Thrips tabaci.

Aus der Ordnung der Hautflügler (Hymenoptera) beispielsweise Athalia rosae, Atta cephalotes, Atta sexdens, Atta texana, Hoplocampa minuta, Hoplocampa testudinea, Monomorium pharaonis, Solenopsis geminata, Solenopsis invicta.

Aus der Ordnung der Wanzen (Heteroptera) beispielsweise Acrostemum hilare, Blissus leucopterus, Cyrtopeltis notatus, Dysdercus cingulatus, Dysdercus intermedius, Eurygaster integriceps, Euchistus impictiventris, Leptoglossus phyllopus, Lygus lineolaris, Lygus pratensis, Nezara viridula, Piesma quadrata, Solubea insularis, Thyanta perditor.

Aus der Ordnung der Pflanzensauger (Homoptera) beispielsweise Acyrthosiphon onobrychis, Adelges laricis, Aphidula nasturtii, Aphis faba , Aphis pomi, Aphis sambuci, Brachycaudus cardui, Br vicoryne brassicae, Cerosipha gossypii, Dreyfusia nordmannianae, Dreyfusia piceae, Dyasphis radicola, Dysaulacorthum pseudosolani, Empoasca fabae, Macrosiphum avenae, Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphon rosae, Megoura viciae, M topolophium dirhodum, Myzodes persica , Myzus cerasi, Nilaparvata lugens, P mphigus bursarius, Perkinsiella saccharicida, Phorodon humuli, Psylla mali, Psylla piri, Rhopalomyzus ascalonicus,

Rhopalosiphum maidis, Sappaphis mala, Sappaphis mali, Schizaphis graminum, Schizoneura lanuginosa, Trialeurodes vaporariorum, Viteus vitifolii.

Aus der Ordnung der Termiten (Isoptera) beispielsweise Calotermes flavicollis, Leucotermes flavipes, R ticulitermes lucifugus, Termes natal nsis.

Aus der Ordnung der Geradflügler (Orthoptera) beispielsweise Acheta domestica, Blatta orientalis, Blattella germanica, Forficula auricularia, Gryllotalpa gryllotalpa, Locusta migratoria, Melanoplus birittatus, Melanoplus femur-rubrum, Melanoplus mexicanus, Melanoplus sanguinipes, Melanoplus spretus, Nomadacris septemfasciata, Periplaneta americana, Schistocerca americana, Schistocerca peregrina, Stauronotus maroccanus, Tachycines asynamorus.

Aus der Klasse der Arachnoidea, beispielsweise Spinnentiere (Acarina) wie Amblyomma americanum, Amglyomma variegatum, Argas persicus, Boophilus annulatus, Boophilus decoloratus, Boophilus microplus, Brevipalpus phoenicis, Bryobia praetiosa, Dermacentor silvarum, Eotetranychus carpini, Eriophyes sheldoni, Hyalomma truncatum, Ixodes ricinus, Ixodes rubicundus, Ornithodorus moubata, Otobins megnini, Paratetranychus pilosus, Permanyssus gallinae, Phyllocaptrata oleivora, Polyphagotarsonemus latus, Psoroptes ovis, Rhipicephalus appendiculatus, Rhipicephalus evertsi, Saccoptes scabiei, Tetranychus cinnabarinus, Tetranychus kanzawai, Tetranychus pacificus, Tetranychus telarius, Tetranychus urticae.

Aus der Klasse der Nematoden, beispielsweise Wurzelgallennematoden, z.B. Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloidogyne javanica, Zysten bildende Nematoden, z.B. Globodera rostochiensis, Heterodera avenae, Heterodera glycinae, Heterodera schatii, Hetrodera triflolii, Stock- und Blattälchen, z.B. Belonolaimus longicaudatus, Ditylenchus destructor, Ditylenchus dipsaci, Heliocotylenchus multicinctus, Longidorus elongatus, Radopholus similis, Rotylenchus robustus, Trichodorus primitivus, Tylenchorhynchus claytoni, Tylenchorhynchus dubius, Pratylenchus neglectus, Pratylenchus penetrans, Pratylenchus curvitatus, Pratylenchus goodeyi.

Bei der Verwendung der Verbindungen I als Insektizide können die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen in größeren Bereichen variiert werden.

Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 70 Gew.-%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

Die Aufwandmenge an Wirkstoff beträgt unter Freilandbedingungen zweckmäßig 0,001 bis 5, vorzugsweise 0.01 bis 3 kg/ha.

#### Synthesebeispiele

Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der Tabelle I mit ihren Schmelzpunkten aufgeführt.

#### Beispiel 1

40

10

70 g 2-Amino-3-cyano-4-oxo-4,5-dihydro-thiophen wurden bei Raumtemperatur in 250 ml Phosphoryl-chlorid (POCl₃) eingetragen. Zu diesem Reaktionsgemisch wurden innerhalb von 20 Minuten 38 ml Dimethylformamid (DMF) zugetropft und die Lösung anschließend eine Stunde bei Raumtemperatur und 2,5 Stunden bei 75°C gerührt. Danach wurde das Gemisch auf 2,5 kg Eis gegeben und der Niederschlag abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum bei 50°C getrocknet. Man erhielt 95,8 g (94 % d. Th.) der Verbindung der Formel

50

vom Schmelzpunkt 161-162°C.

55

#### Beispiel 2

69 g 2-Aldoximo-2-amino-3-cyano-4-oxo-4,5-dihydro-thiophen wurden bei Raumtemperatur in 135 ml

Phosphorylchlorid (POCl<sub>3</sub>) eingetragen. Zu diesem Reaktionsgemisch wurden innerhalb von 20 Minuten 20 ml Dim thylformamid (DMF) zugetropft und die Lösung anschließ nd eine Stund bei 20°C und 3 Stunden bei 75°C gerührt. Danach wurde das Gemisch auf 1 kg Eis gegeben, der Niederschlag abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum bei 50°C getrocknet. Man erhielt 50,2 g (81 % d. Th.) der Verbindung der Formel

C1 C1

vom Schmelzpunkt 155-157° C.

5 Beispiel 3

10

25

30

50

55

Variante a:

In 150 ml tert.-Butanol wurden 2,5 g elementares Natrium gelöst. Hierzu wurden 10,2 g 4,5-Dichlorthieno[2,3-d]pyrimidin (Beispiel 1) gegeben. Das Reaktionsgemisch wurde eine Stunde bei 20°C und 4
Stunden bei 50°C gerührt. Anschließend wurde das Reaktionsgemisch in 500 ml Wasser eingerührt und mit
Salzsäure auf pH 7 eingestellt. Der Niederschlag wurde abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum
bei 50°C getrocknet. Man erhielt 7,6 g (37 % d. Th.) der Verbindung der Formel

C1 NH

vom Schmelzpunkt 245-248°C.

Variante b:

In 67 ml DMF wurden 20,5 g 4,5-Dichlor-thieno[2,3-d]pyrimidin (Beispiel 1) gelöst. Hierzu wurden bei Raumtemperatur 17,6 g 25 gew.-%ige wäßrige Natronlauge getropft. Das Reaktionsgemisch wurde 16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wurden weitere 17,6 g 25 gew.-%ige wäßrige Natronlauge zugetropft. Nach 24 Stunden Rühren bei 20°C wurde das Reaktionsgemisch auf 500 ml Wasser gegeben und mit Salzsäure auf pH 7 eingestellt. Der Niederschlag wurde abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum bei 50°C getrocknet. Man erhielt 16,4 g (88 % d. Th.) der Verbindung, welche mit dem nach Variante a erhaltenen Produkt identisch ist.

#### Beispiel 4

20,5 g 4,5-Dichlor-thieno[2,3-d]pyrimidin (Beispiel 1) wurden in 150 ml Methanol suspendiert. Hierzu wurden 13,3 g Natriummethanolat gegeben. Danach wurde das Reaktionsgemisch eine Stunde bei Raumtemperatur und eine weitere Stunde bei 50-60°C gerührt. Anschließend wurde das Reaktionsgemisch auf 500 ml Wasser gegeben, der Niederschlag abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum bei 50°C getrocknet. Man erhielt 15 g (75 % d. Th.) der Verbindung der Formel

mit inem Schmelzpunkt von 145-146°C.

#### Beispiel 5

5 g 5-Chlor-4-thio-3,4-dihydro-thi no[2,3-d]pyrimidin wurden in 50 ml DMF und 5 ml Triethylamin gelöst. Hierzu wurden tropfenweise 5,4 g Bromethan gegeben. Das Reaktionsg misch wurd 4 Stund n b i Raumtemperatur gerührt und anschli ßend in 500 ml Wass r eingerührt. Der Niederschlag wurd abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum bei 50°C getrocknet. Man erhielt 4,9 g (85 % d. Th.) der Verbindung der Formel

10

mit einem Schmelzpunkt von 64-66°C.

#### Beispiel 6

10,2 g 4,5-Dichlor-thieno[2,3-d]pyrimidin (Beispiel 1) wurden in 50 ml DMF und 4,5 g Pyridin gelöst.

Hierzu wurden bei Raumtemperatur 4,5 g n-Butanthiol gegeben. Das Reaktionsgemisch wurde eine Stunde bei Raumtemperatur und weitere 2 Stunden bei 50-60° C gerührt. Anschließend wurden im Vakuum 10 ml Lösungsmittel abdestilliert. Der Rückstand wurde auf 500 ml Wasser gegeben, der Niederschlag abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum bei 50° C getrocknet. Man erhielt 9 g (70 % d. Th.) der Verbindung der Formel

25

30

mit einem Schmelzpunkt von 118-120°C.

#### Beispiel 7

35

20,5 g 4,5-Dichlor-thieno[2,3-d]pyrimidin (Beispiel 1) wurden in 67 ml Dimethylforamid (DMF) gelöst. Hierzu wurden 12,4 g conc. Ammoniak, gelöst in 12 ml Wasser, getropft und das Reaktionsgemisch wurde 15 Stunden bei 50°C gerührt. Anschließend wurde das Gemisch auf 500 ml Wasser gegeben und der Niederschlag abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum bei 50°C getrocknet. Man erhielt 15,5 g (84 % d. Th.) der Verbindung der Formel

45

vom Schmelzpunkt 260-262° C.

#### 50 Beispiel 8

Zu 50 ml einer 40 % wäßrigen Methylaminlösung in 20 ml Dimethylformamid wurden bei 20°C 15 g 4,5-Dichlor-thieno[2,3-d]pyrimidin (Beispiel 1) gegeben. Das Reaktionsgemisch wurde 4 Stunden bei 20°C gerührt. Anschließend wurde das Gemisch in 500 ml Wasser gegeben und der Niederschlag abgesaugt. Der Niederschlag wurde mit Wasser gewaschen und im Vakuum getrocknet. Man erhielt 11,5 g (79 % d. Th.) d r Verbindung d r Formel

vom Schmelzpunkt 211-212°C.

#### Beispiel 9

10

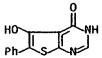
12.1 q 4-Chlor-3-cyano-5-formyl-2-dimethylaminoformamidinothiophen und 50 ml Chlorbenzol wurden 3 Stunden bei Raumtemperatur sowie weitere 6 Stunden bei 100°C mit gasförmigem HCl begast. Anschließend wurde überschüssiges HCI mit Preßluft entfernt. Dem Reaktionsgemisch wurde dann 50 ml Wasser zugesetzt. Der sich daraufhin gebildete Niederschlag wurde abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum getrocknet. Es wurden 5,6 g (52 %) der Verbindung der Formel

20

vom Schmelzpunkt 212°C (Zersetzung) erhalten.

#### Beispiel 10

33 g 2-Amino-3-carboxamido-4-oxo-4,5-dihydro-5-phenyl-thiophen wurden in 200 ml Ameisensäure 14 Stunden bei 100°C und weitere 16 Stunden unter Rückfluß gerührt. Nach dem Abkühlen wurde der Niederschlag abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum getrocknet. Es wurden 21,8 g (64 %) der Verbindung der Formel



35

vom Schmelzpunkt über 290°C erhalten.

#### Beispiel 11

#### Variante a:

50

55

Zu einer Suspension von 14 g 2-Amino-3-cyano-4-oxo-4,5-dihydro-thiophen und 50 ml Phosphorylchlorid wurden portionsweise 19,6 g Benzoesäuremorpholid zugegeben. Anschließend wurde das Reaktionsgemisch eine Stunde bei Raumtemperatur und weitere drei Stunden bei 78°C gerührt. Dann wurde das Reaktionsgemisch in 500 ml Eiswasser gegossen. Der dabei angefallene Niederschlag wurde abfiltriert, mit Wasser gewaschen und im Vakuum getrocknet. Es wurden 23,3 g (83 %) der Verbindung der Formel

vom Schmelzpunkt 138 - 140°C erhalten.

#### Variante b:

Zu einer Suspension von 70 g 2-Amino-3-cyano-4-oxo-4,5-dihydro-thiophen und 250 ml Phosphorylchlorid wurden 88,5 g Benzoesäurediethylamid zugegeben. Danach wurde das Reaktionsgemisch 0,5 Stunden bei 20°C und 3 Stunden bei 78°C gerührt. Dann wurde das Reaktionsgemisch in 500 ml Eiswasser gegossen. Der dabei angefallene Niederschlag wurd abfiltriert, mit Wasser gewaschen und im Vakuum getrocknet. Dabei fielen 10,7 g (76 %) der unter Variante a erhaltenen Verbindung an.

In analoger Weise lassen sich die in Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen herstellen.

Tabelle 1

1	0

Bsp	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Doct 1	2 5 -1 5/	
		RESURE	KeSt I	R3 Rest R4.	Schmelz- punkt (°C)
12	н	Cl	cı	CH <sub>3</sub>	97- 99
13	н	0-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	cı	н	124
14	Н	0-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C1	н	105-107
15	Н	O-isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C1	н	80- 81
16	H	O-nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	94- 95
17	н	O-isoC4Hg	Cl	н	79- 80
18	Н	O-CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>	cı	н	66- 67
19	Н	O-sekC4H9	Cl	н	öl
20	Н	0-nC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	cı	н	65- 66
21	Н	0-NeoC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	cı	н	
22	Н	O-nC <sub>6</sub> H <sub>1 3</sub>	C1	н	öl
23	Н	0-nC <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	C1	н	öl
24	Н	0-nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	cı	. Н	öl
25	Н	O-isoC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	cı	н	
26	н	O-nC <sub>9</sub> H <sub>1</sub> 9	cı	н	
27	н	0-nC <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	Cl	н	
28	н	O-nC <sub>11</sub> H <sub>23</sub>	C1	н	
29	н	0-nC <sub>1 2</sub> H <sub>25</sub>	cı	н	
30	н	0-nC <sub>1 3</sub> H <sub>27</sub>	Cl	н	
31	н	O-nC <sub>14</sub> H <sub>31</sub>	cı	Н	
32	н	O-nC <sub>15</sub> H <sub>31</sub>	cı	н	
33	Н	O-nC <sub>16</sub> H <sub>31</sub>	C1	н	
34	Н	O-nC <sub>17</sub> H <sub>33</sub>	Cl	н	
35	Н	O-nC <sub>18</sub> H <sub>35</sub>	Cl	н	
36	н	O-nC <sub>19</sub> H <sub>37</sub>	cı	н	
37	н	0-nC <sub>20</sub> H <sub>39</sub>	cı	н	
38	н	0-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	C1	Н	95- 98
	12 13 14 15 16 17 18 19 20 21 22 23 24 25 26 27 28 29 30 31 32 33 34 35 36 37	12 H 13 H 14 H 15 H 16 H 17 H 18 H 19 H 20 H 21 H 22 H 23 H 24 H 25 H 26 H 27 H 28 H 29 H 30 H 31 H 32 H 33 H 34 H 35 H 36 H 37 H	12 H C1 13 H O-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> 14 H O-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> 15 H O-isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> 16 H O-nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> 17 H O-isoC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> 18 H O-CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> 19 H O-sekC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> 20 H O-nC <sub>5</sub> H <sub>11</sub> 21 H O-NeoC <sub>5</sub> H <sub>11</sub> 22 H O-nC <sub>6</sub> H <sub>13</sub> 23 H O-nC <sub>7</sub> H <sub>15</sub> 24 H O-nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub> 25 H O-nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub> 26 H O-nC <sub>9</sub> H <sub>19</sub> 27 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>23</sub> 28 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>23</sub> 29 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>23</sub> 29 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>23</sub> 31 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>31</sub> 32 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>31</sub> 33 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>31</sub> 34 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>31</sub> 35 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>35</sub> 36 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>37</sub> 37 H O-nC <sub>2</sub> OH <sub>39</sub>	12 H C1 13 H O-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> C1 14 H O-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> C1 15 H O-isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> C1 16 H O-nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> C1 17 H O-isoC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> C1 18 H O-CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> C1 19 H O-sekC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> C1 20 H O-nC <sub>5</sub> H <sub>11</sub> C1 21 H O-NeoC <sub>5</sub> H <sub>11</sub> C1 22 H O-nC <sub>6</sub> H <sub>13</sub> C1 23 H O-nC <sub>7</sub> H <sub>15</sub> C1 24 H O-nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub> C1 25 H O-isoC <sub>8</sub> H <sub>17</sub> C1 26 H O-nC <sub>9</sub> H <sub>19</sub> C1 27 H O-nC <sub>1</sub> OH <sub>21</sub> C1 28 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>23</sub> C1 29 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>25</sub> C1 30 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>25</sub> C1 31 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>31</sub> C1 32 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>31</sub> C1 33 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>31</sub> C1 34 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>31</sub> C1 35 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>33</sub> C1 36 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>35</sub> C1 37 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>37</sub> C1 37 H O-nC <sub>2</sub> OH <sub>39</sub> C1	12 H Cl Cl CH <sub>3</sub> 13 H O-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> Cl H 14 H O-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> Cl H 15 H O-isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> Cl H 16 H O-nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> Cl H 17 H O-isoC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> Cl H 18 H O-CH <sub>2</sub> CH(OCH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> Cl H 19 H O-sekC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> Cl H 20 H O-nC <sub>5</sub> H <sub>11</sub> Cl H 21 H O-NeoC <sub>5</sub> H <sub>11</sub> Cl H 22 H O-nC <sub>6</sub> H <sub>13</sub> Cl H 23 H O-nC <sub>7</sub> H <sub>15</sub> Cl H 24 H O-nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub> Cl H 25 H O-nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub> Cl H 26 H O-nC <sub>9</sub> H <sub>19</sub> Cl H 27 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>21</sub> Cl H 28 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>21</sub> Cl H 29 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>23</sub> Cl H 30 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>25</sub> Cl H 31 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>3</sub> H <sub>31</sub> Cl H 32 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>3</sub> H <sub>31</sub> Cl H 33 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>31</sub> Cl H 34 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>31</sub> Cl H 35 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>31</sub> Cl H 36 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>33</sub> Cl H 37 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>33</sub> Cl H 38 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>31</sub> Cl H 39 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>31</sub> Cl H 30 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>31</sub> Cl H 31 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>31</sub> Cl H 32 H O-nC <sub>1</sub> H <sub>31</sub> Cl H

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	39	н	O-CH <sub>2</sub> -C≅CH	C1	н .	154-156
	40	Н	O-Cyclopropyl	cı	Н	
10	41	Н	O-Cyclobutyl	Cl	н	
	42	Н	O-Cyclopentyl	Cl	Н	85- 87
	43	н	O-Cyclohexyl	Cl	Н	90- 94
15	44	н, ,	O-Cycloheptyl	C1	н	.öl
15	45	Н	O-Cyclooctyl	Cl	Н	
	46	Н	O-Cyclonony1	Cl	Н	
	47	Н	O-Cyclodecyl	cı	н	
20	48	н	O-Cyclododecyl	Cl	Н	
	49	н	O-Cyclohexyl-(2)-CH <sub>3</sub>	Cl	Н	
	50	Н	O-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	106-108
oe.	51	Н	O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-CH <sub>3</sub>	Cl	Н	
25	52	Н	O-CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	99-100
	53	н	O-CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-CH <sub>3</sub>	Cl	Н	
	54	Н	O-CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Cl	Н	
30	55	н	O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	77- 78
	56	н	O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-OCH <sub>3</sub>	C1	Н	
	57	H	0-сн <sub>2</sub> сн <sub>2</sub> он	Cl	H	
05	58	Н	O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	Н	107-109
35	59	Н	0-сн <sub>2</sub> сн <sub>2</sub> ос <sub>2</sub> н <sub>5</sub>	Cl	Н	104-105
	60	Н	O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	н	60- 62
	61	Н	O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	
40	62	Н	O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -NH-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	Cl	Н	117-119
	63	н	O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	н	80- 84
	64	н	O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	Н	
45	65	н	O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OH	Cl	Н	
45	66	Н	O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	Н	
	67	Н	O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	
	68	Н	0-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	Н	
50	69	н	O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	н	
	70	н	O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	н	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	71	н	0-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	Н	
	72	н	O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> O-nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	Н	
10	73	н	O-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	C1	н	
	74	Н	O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -CH <sub>2</sub> Cl	Cl	Н	
	75	Н	O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH <sub>2</sub> Cl	cı	Н	
15	76	н	S-H	Cl	Н	264
15	77	Н	S-CH <sub>3</sub>	cı	Н	
	78	н	S-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	Н	271
	79	Н	S-iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	Н	260 -
20	80	Н	S-iso-C4H9	cı	Н	153-155
	81	Н	S-sek-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C1	н	148-150
	82	н	S-tert-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	н	160-163
	83	Н	S-n-C <sub>6</sub> H <sub>1 3</sub>	C1	Н	
25	84	Н	S-n-C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	C1	н	
	85	н	S-n-C <sub>12</sub> H <sub>25</sub>	C1	Н	
	86	H	S-n-C <sub>16</sub> H <sub>33</sub>	C1	н	
30	87	н	S-n-C <sub>18</sub> H <sub>37</sub>	Cl	н	
	88	Н	S-Cyclohexyl	C1	н	
	89	Н	S-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	181-182
	90	н	S-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-CH <sub>3</sub>	Cl	н	
35	91	Н	S-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-OH	Cl	Н	
	92	Н	S-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-OCH <sub>3</sub>	Cl	н	
	93	Н	S-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-Cl	C1	Н	
40	94	Н	S-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -(2,6)-Cl <sub>2</sub>	Cl	Н	
	95	Н	S-CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C1	н	
	96	н	S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OH	Cl	Н	
	97	н	S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	cı	н	
45	98	н	S-CH2CH(CH3)-OH	C1	Н	
	99	Н	S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -COOH	C1	н	
	100	н	S-CH(CH3)-COOH	Cl	Н	
50	101	Н	S-CH <sub>2</sub> -COOH	Cl	Н	
	102	н	S-CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>	c1	Н	105-108

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	103	н	S-CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	105-107
	104	Н	S-CH <sub>2</sub> -{2}-Fury1	Cl	н	
10	105	Н	SCN	CI	н	208-210
	106	н	F	Cl	H	
	107	н	CN	Cl	Н	
	108	н	N <sub>3</sub>	Cl	Н	208 Zers.
15	109	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	Öl
	110	Н	0-CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	92- 93
	111	н	0-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	74- 75
20	112	H	0-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	108-109
	113	н	S-H	cı	CH <sub>3</sub>	241-243
	114	H	S-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	131-133
	115	н	S-CH <sub>2</sub> -C00C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	94- 98
25	116	н	Cl	Cl	CHC1 <sub>2</sub>	125-130
	117	н	Cl	C1	CN	155-157
	118	н	CH2COOC2H5	Cl	н	91- 92
30	119	н	CH(COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	Н	112-113
30	120	H	CH(CN) <sub>2</sub>	Cl	Н	
-	121	H	CH(CN)COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	158-159
	122	н	CH(CN)COOCH <sub>3</sub>	CI	Н	
35	123	н	CH (COOCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C1.	Н	
	124	H	CH(CN)C6H5	C1	H	
	125	н	NH-NH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	
	126	H	NH-N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	Н	
40	127	Н	S-n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	C1	н	
	128	H	S-Neo-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	Cl	Н	
	129	Н	N(CH <sub>3</sub> )-NH-CH <sub>3</sub>	Cl	Н	
45	130	H	ОН	ОН	Н	
	131	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	ОН	ОН	Н	
	132	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Cl	н	
	133	nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	ОН	ОН	Н	
50	134	nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C1	Cl	н	
	135	isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	он	ОН	н	

EP 0 447 891 A1

Tabelle l (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1 R	est R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	136	isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	C1	Н	
	137	nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	он	ОН	н	
	138	пС4Н9	C1	Cl	Н	
10	139	CycloC <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	ОН	ОН	н	
	140	CycloC <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	cı	Cl	н	
	141	CycloC <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	ОН	ОН	н	
	142	CycloC <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	cı	Cl	H	
15	143	н	NH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C1	н	134-135
	144	Н	NH-nC 3H7	Cl	н	71- 75
	145	Н	NH-isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	н	119-120
20	146	Н	NH-nC4Hg	Cl	Н	71- 75
	147	Н	NH-sekC4H9	Cl	Н	54- 58
	148	H·	NH-isoC4H9	Cl	Н	88- 90
	149	Н	NH-tertC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	Н	80- 81
25	150	Н	NH-nC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	Cl	Н	76- 77
	151	Н	NH-sekC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	Cl	H	Öl
	152	Н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	н	
	153	Н	NH-NeoC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	Cl	H	111-114
30	154	H	NH-nC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	Cl	H	50
	155	Н	NH-nC7H15	Cl	н	64
	156	Н	NH-nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	Cl	H	54- 56
22	157	Н	NH-nCgH <sub>19</sub>	Cl	Н	60- 65
35	158	Н	NH-nC <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	Cl	Н	
	159	Н	NH-nC <sub>12</sub> H <sub>25</sub>	Cl	н	
	160	Н	NH-nC <sub>13</sub> H <sub>27</sub>	Cl	H	
40	161	Н	NH-nC <sub>16</sub> H <sub>33</sub>	Cl	н	
	162	Н	NH-nC <sub>18</sub> H <sub>37</sub>	Cl	Н	
	163	Н	NH-CH(CH3)CH2CH2CH3	Cl	н	Öl
	164	H	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	н	Öl
45	165	н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	н	Öl
	166	Н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -CH <sub>3</sub>	Cl	Н	
	167	н	NH-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -CH <sub>3</sub>	Cl	н	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R <sup>1</sup>	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	168	Н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C1	н	öl
	169	н	(R)-(-)-NH-CH(CH <sub>3</sub> )-Cyclohexyl	Cl	н	
10	170	н	(S)-(+)-NH-CH(CH <sub>3</sub> )-Cyclohexyl	Cl	н	
	171	н	NH-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -Cyclohexyl	Cl	н	69- 71
	172	H	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OH	Cl	н	143-145
	173	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	C1	н	115-117
15	174	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	80- 83
	175	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	
	176	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OH	Cl	н	
	177	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OH	Cl	Н	
20	178	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -NH <sub>2</sub>	Cl	Н	
	179	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	Н	146-148
	180	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	н	67- 70
25	181	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -N(iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>	cı	Н	
20	182	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Piperazin-(1)-y1	Cl	н	
	183	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OH	Cl	Н	114-116
	184	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>3</sub>	Cl	Н	
30	185	H	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C1	H	80- 83
	186	н	NH~(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C1	Н	42- 43
	187	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	
	188	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	Öl
35	189	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-CH <sub>3</sub>	Cl	Н	
	190	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	
	191	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	Öl
	192	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -NH <sub>2</sub>	C1	н	228-230
40	193	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C1	н	112-115
	194	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	Н	66- 68
	195	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -N(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	H	
45	196	н	$NH-(CH_2)_3-Morpholin-(1)-yl$	C1	Н	
<b>₩</b>	197	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -OH	Cl	н	
	198	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -NH <sub>2</sub>	C1	н	
	199	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -OH	Cl	н	

50

EP 0 447 891 A1

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest	R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R <sup>4</sup>	Schmelz- punkt (°C)
3	200	н	<del> </del>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -NH <sub>2</sub>	Cl	н	
	201	н		NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -NH <sub>2</sub>	cı	Н	
	202	н		NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -NH <sub>2</sub>	C1	Н	
10	203	Н		NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>9</sub> -NH <sub>2</sub>	C1	Н	
	204	н		NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>10</sub> -NH <sub>2</sub>	C1	Н	
	205	н		NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>12</sub> -NH <sub>2</sub>	cı	Н	
	206	Н	NH-CI	1(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -N(C <sub>2</sub> H) <sub>2</sub> x HC1	C1	H	165-170
15	207	н		NH-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-OH	cı	н	
	208	н		NH-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -OH	Cl	Н	
	209	н		NH-CH <sub>2</sub> -(2)-Thienyl	C1	Н	
	210	н		NH-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -OH	cı	Н	•
20	211	н		NH-C(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> -OH) <sub>2</sub>	cı	н	
	212	н		NH-CH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-CH <sub>2</sub> -OH	C1	Н	
	213	н		NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -COOH	Cl	Н	
25	214	н		NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -COOH	C1	н	
	215	H		NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>10</sub> -COOH	Cl	н	
	216	н		NH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	86- 88
	217	н		NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-CH <sub>3</sub>	cı	н	126-128
30	218	н		NH-C6H4-(3)-CH3	CI	н	116-118
	219	н		NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-CH <sub>3</sub>	Cl	н	162-165
	220	Н		NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	94- 96
	221	Н		NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	71- 73
35	222	н		NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-CF <sub>3</sub>	Cl	H	
	223	Н		NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(3)-CF <sub>3</sub>	Cl	н	98-100
	224	Н		NH-C6H4-(4)-CF3	Cl	н	
40	225	н		NH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -(2)-OH	Cl	Н	218-220
40	226	Н		NH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -(3)-OH	Cl	Н	238-241
	227	Н		NH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -(4)-OH	Cl	н	219-222
	228	н		NH-C6H4-(2)-OCH3	Cl	Н	167-169
45	229	н		NH-C6H4-(3)-OCH3	C1	Н	114-115
	230	Н		NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-OCH <sub>3</sub>	Cl	Н	104-107
	231	н		NH-C6H4-(2)-OC2H5	cı	Н	152-153

EP 0 447 891 A1

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	232	Н	NH-C6H4-(3)-OC2H5	Cl	н	93- 95
	233	Н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	128-130
	234	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-Cl	Cl	н	126-130
10	235	Н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(3)-C1	Cl	н	135-137
	236	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-C1	Cl	Н	191-195
	237	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-F	Cl	Н	
	238	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(3)-F	Cl	H	
15	239	H	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-F	Cl	Н	
	240	H	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-Br	cl	н	
	241	H	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(3)-Br	Cl	Н	
20	242	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-Br	Cl	н	
	243	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-I	Cl	н	
	244	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(3)-1	Cl	н	
	245	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-I	Cl	Н	
25	246	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-NH <sub>2</sub>	cı	н	154-156
	247	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(3)-NH <sub>2</sub>	Cl	н	182-185
	248	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-NH <sub>2</sub>	Cl	н	184-185
	249	н	$NH-C_6H_4-(4)-NH-COCH_3$	cı	н	210-212
30	250	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-CH <sub>2</sub> OH	C1	н	
	251	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(3)-CH <sub>2</sub> OH	cı	Н	
	252	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-COCH <sub>3</sub>	cı	н	194-195
_	253	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-COOH	Cl	н	
35	254	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(3)-COOH	C1	н	
	255	н	NH-C6H4-(4)-COOH	Cl	н	
	256	н	NH-C6H4-(2)-CONH2	Cl	н	
40	257	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-CONH <sub>2</sub>	C1	н	
	258	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-CN	C1	Н	
	259	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(3)-CN	Cl	н	
	260	Н	NH-C <sub>5</sub> H <sub>4</sub> -(4)-CN	Cl	H	210-213
45	261	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -(2,6)-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	н	
	262	н	$NH-C_6H_3-(3,5)-(CH_3)_2$	Cl	н	
	263	н	$NH-C_6H_3-(2)-OH-(5)-CH_3$	cı	Н	

Tabelle 1 (F rtsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R <sup>1</sup>	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	264	Н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -(2)-OH-(4)-CH <sub>3</sub>	Cl	Н	258
	265	Н	$NH-C_6H_3-(2)-OH-(2)-CH_3$	cı	H	
40	266	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> -(2)-OH-(5)-Cl	Cl	н	
10	267	н	NH-(2)-Pyridyl	Cl	Н	175- 6
	268	н	NH-(3)-Pyridyl	Cl	Н	138-140
	269	н	NH-(4)-Pyridyl	<b>C1</b>	н	
15 .	270	Н	NH-(2)-(4'-Methyl-pyridyl)	Cl	н	
	271	н	NH-(2)-(5'-Methyl-pyridyl)	cı	Н	
	272	н	NH-(2)-(6'-Methyl-pyridyl)	Cl	Н	
	273	Н	NH-CH <sub>2</sub> -(3)-Pyridyl	Cl	H	
20	274	н	NH-CH <sub>2</sub> -(2)-Furyl	Cl	Н	
	275	н	NH-CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	98- 99
	276	н	NH-CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-OCH <sub>3</sub>	Cl	H	
25	277	н	NH-CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-OCH <sub>3</sub>	Cl	н	118-120
	278	Н	NH-CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-F	Cl	н	
	279	н	NH-CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-C1	<b>c</b> 1	н	
	280	н	NH-CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-Cl	Cl	Н	
30	281	н	$NH-CH_2-C_6H_3-(3,4)-(OCH_3)_2$	Cl	Н	
	282	Н	NH-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	cı	Н	83
	283	Н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> (+/-)	Cl	н	76- 78
35	284	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	cı	Н	
	285	н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	
	286	н	NH-Cyclopropyl	C1	Н	87
	287	н	NH-Cyclopentyl	C1	Н	79- 80
40	288	н	NH-Cyclohexyl	cı	Н	85- 86
	289	н	NH-Cycloheptyl	Cl	Н	62- 63
	290	Н	NH-Cyclooctyl	Cl	н	43- 48
45	291	н	NH-Cyclododecyl	C1	Н	119-122
	292	н	NH-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	C1	Н	85- 86
	293	н	NH-CH <sub>2</sub> -C≡CH	Cl	н	171-173
	294	н	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	н	108-110
50	295	н	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	н	42- 45

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	R st R <sup>4</sup>	Schmelz- punkt (°C)
	296	Н	N(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>	C1	Н	Öl
	297	н	N(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )2	Cl	н	Öl
10	298	н	N(iso-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> ) <sub>2</sub>	cı	н	69- 72
	299	н	N(n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub> ) <sub>2</sub>	cı	н	öl
	300	н	N(sek-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> ) <sub>2</sub>	cı	н	
15	301	н -	N(iso-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub> ) <sub>2</sub>	C1	Н .	
	302	н	N(n-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub> ) <sub>2</sub>	cı	н	öl
	303	н	N(CH(C2H5)-(CH2)4-CH3)2	Cl	H	
	304	н	N(n-C <sub>8</sub> H <sub>17</sub> ) <sub>2</sub>	C1	н	
20	305	н	N(CH2-CH=CH2)2	Cl	н	Öl
	306	н	N(Cyclohexyl) <sub>2</sub>	C1	н	öl
	307	н	N(CH <sub>3</sub> )-nC <sub>4</sub> H <sub>g</sub>	C1	н	
25	308	H	N(CH <sub>3</sub> )-Cyclohexyl	C1	н	
	309	н	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-Cyclohexyl	cı	н	Ö1
	310	н	N(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OH	cı	н	
	311	н	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	н	
<b>30</b>	312	н	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-(CH) <sub>2</sub> -OH	Cl	Н	
	313	Н	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(OH)-CH <sub>3</sub>	cı	H	
	314	н	N(tert-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OH	Cl	H	
35	315	н	N(CH <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	cı	Н	165-167
	316	Н	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C1	Н	
	317	н	N(iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	
	318	Н	N(nC4H <sub>9</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	
40	319	Н	N(CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	н	101-102
	320	Н	N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C1	Н	
	321	н	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	
45	322	Н	N(iso-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	
••	323	Н	N(tert-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	
	324	н	N(CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OH	Cl	Н	
	325	Н	N(C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	
50	326	H	$N(CH_2C_6H_5) - ((CH_2)_2 - C_6H_5)$	Cl	н	
	327	н	Pyrrolidino	Cl	н	110-112

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R³	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	328	н	Piperidino	C1	н	102-105
	329	Н	Hexamethylenimino	Cl	Н	255-256
	330	н	Morpholino	Cl	Н	162-165
10	331	н	N-Methylpiperazino	Cl	Н	116-120
	332	н	NH-NH <sub>2</sub>	C1	н	229-230
	333	Н	NH-NH-CH <sub>3</sub>	Cl	Н	
45	334	H .	NH-NH-C6H5	cı	H	134-136
15	335	н	NH-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	Н	
	336	н	NH-Morpholin-(1)-yl	Cl	н	
	337	н	NH-Hexamethylenimino-(1)-yl	Cl	Н	
20	338	H	NH-OH	Cl	H	
	339	CH <sub>3</sub>	NH-CH <sub>3</sub>	Cl	Н	148-150
	340	CH <sub>3</sub>	NH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	208-210
	341	CH <sub>3</sub>	NH-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	н	150-151
25	342	CH <sub>3</sub>	NH-isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	H	
	343	CH <sub>3</sub>	NH-sekC4H9	Cl	н	187-190
	344	CH <sub>3</sub>	NH-nC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	Cl	Н	60- 62
	345	CH <sub>3</sub>	NH-Cyclohexyl	Cl	Н	
30	346	CH <sub>3</sub>	NH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	109-112
	347	CH <sub>3</sub>	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	н	208-210
	348	CH <sub>2</sub> Cl	NH-CH <sub>3</sub>	Cl	H	
35	349	CH <sub>2</sub> Cl	NH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	93- 97
33	350	н	NH-CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	186-187
	351*)	н	NH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	128-130
	352*)	н	NH-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	61- 65
40	353*)	Н	NH-nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	61- 65
	354	н	NH-sekC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	101-102
	355	н	NH-nC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	43- 44
45	356	н	NH-nC <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	53- 54
	357	H	NH-C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OH	Cl	CH <sub>3</sub>	155-159
	358	н	NH-C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -OCH <sub>3</sub>	C1	CH <sub>3</sub>	87- 88
	359	н	NH-Cyclohexyl	Cl	CH <sub>3</sub>	111-112

<sup>50 \*)</sup> HCl-Salz

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	360	н	NH-C6H5	Cl	CH <sub>3</sub>	169-171
	361	Н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(3)-CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	152-154
10	362	Н	NH-CH2-C≡CH	cı	CH <sub>3</sub>	183-186
	363	Н	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	60- 64
	364	H	Pyrrolidino	cı	CH <sub>3</sub>	75- 76
15	365	Н	Piperidino	Cl	CH <sub>3</sub>	128-130
	366	Н	Morpholino	Cl	CH <sub>3</sub>	105-106
	367	H	NH-NH <sub>2</sub>	cı	CH <sub>3</sub>	194-195
	368	н	NH-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	CN	99-102
20	369	H	NH-nC4H9	Cl	CN	90- 92
	370	H	NH-sekC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C1	CN	82- 84
	371	н	NH-nC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	Cl	CN	82- 84
	372	Н	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	CN	60- 62
25	373	н	NH-CH <sub>3</sub>	Cl	CH=N-CH <sub>3</sub>	206-208
25	374	Н	NH-isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C1 C	H=N-isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	105-112
	375	Н	(R/S)-NH-CH(CH <sub>3</sub> )-Cyclohexyl	Cl	Н	
	376	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -N(n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	Н	
30	377	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -N(isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>	C1	Н	
	378	н	NH-(+)-CH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	
	379	H	NH-(-)-CH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	
	380	н	NH-Cyclobutyl	Cl	Н	
<b>35</b>	381	Н	NH-Adamantyl	Cl	Н	
	382	H	NH-Cyclononyl	Cl	Н	
	383	Н	NH-Cyclodecyl	Cl	Н	
	384	н	NH-Metallyl	Cl	H	
40	385	Н	N(IsoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>	CI	Н	
	386	н	N-Ethylpiperazino	Cl	Н	
	387	Н	Thiomorpholino	Cl	Н	
45	388	Н	NH-NH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	
45	389	н	NH-N (C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	н	
	390	Н	N(CH <sub>3</sub> )-NH-CH <sub>3</sub>	Cl	Н	
	391	н	Imidazol-l-yl	Cl	н	

50

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R <sup>1</sup>	Rest R <sup>2</sup>	Rest	R <sup>3</sup> Rest R <sup>4</sup>	Schmelz- punkt (°C)
	392	Н	Pyrazol-1-yl	C1	Н	
	393	н	Triazol-1-yl	cı	н	
10	394	н	Tetrazol-1-yl	Cl	н	
	395	н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	н	Ö1
396	396	Н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CN	Cl	н	123-125
15	397	Н	N(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CN	cı	, <b>, H</b>	84- 90
10	398	н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	н	öl
3	399	н	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	ö١
	400	CH <sub>3</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OH	Cl	н	150-152
20	401	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -COOH	Cl	н	187-190
	402	н	NH-nC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	Cl	CN	64- 65
	403	н	SCN	Cl	CH <sub>3</sub>	162-165
	404	Н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH=N-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	180-183
25	405	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -Cyclohexyl	Cl	CH <sub>3</sub>	73- 74
	406	Н	NH-nC7H15	Cl	CN	64- 65
	407	н	NH-nC 3H7	Cl	CH=N-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	77- 83 .
30	408	н	NH-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	82- 84
	409	н	NH—nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	41- 43
	410	Н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	121-123
2	411	н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	öl
35	412	Н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C1	CH <sub>3</sub>	öl
	413	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	71- 72
	414	Н	NH-CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	133-134
40	415	Н	NH-nC <sub>9</sub> H <sub>19</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	Ö1
	416	Н	$NH-C_6H_2-(4)-NH_2-(3,5)-Cl_2$	Cl	н	242
	417	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -0-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OC <sub>2</sub>	H <sub>5</sub> Cl	н	öl
	418	Н	NH-CH(CH3)-(CH2)2CH(CH3)2	cı	CH <sub>3</sub>	öl
45	419	н	O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	н	öl
	420	Н	O-CH(CH3)-CH2OC6H5	¢١	н	80- 82
	421	н	S—CH <sub>2</sub> C≡CH	Cl	н	170-172
50	422	н	S-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	C1	н	58- 62
	423	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(4)-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	сı	н	158-162

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	424	Н	NH-nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	Cl	CN	45-46
	425	H	NH-CH2-CH(C2H5)-(CH2)3CH3	Cl	н	ö1
	426	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CN	70-74
10	427	н	N(CH2CH2OCH3)2	Cl	н	öl
	428	н	S-nC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	Cl	н	170-172
	429	Н	S-CH(CH2CH2CH3)-(CH2)3CH3	Cl	Н	ö1
	430	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> -CH=CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	Н	öl
15	431	CH <sub>3</sub>	Cl	C1	Н	126-130
	432	CH <sub>2</sub> Cl	Cl	Cl	н	120-124
	433	н	Thiomorpholino-S,S-dioxid	Cl	н	über 300
20	434	н	NH—CH 3	C1	СНО	
	435	Н	NH-C 2H5	C1	СНО	
	436	н	NH—nC 3H7	Cl	СНО	
	437	н	NH—i soC 3H7	cı	СНО	
25	438	Н	NH—nC4Hg	Cl	CHO	
	439	н	NH—i soC4H9	cı	СНО	
	440	н	NH—secC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C1	СНО	
	441	н	NH—tertC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	cı	СНО	
30	442	н	NH nC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	C1	СНО	
	443	Н	NH—NeoC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	C1	СНО	
	444	Н	NH—nC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	cı	СНО	85-87
oe.	445	Н	NH-nC7H15	cı	СНО	
35	446	н	NH—nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	Cl	СНО	49-54
	447	Н	NH-nCgH <sub>1</sub> g	cı	СНО	
	448	H	NH—nC <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	Cl	СНО	Ö1
40	449	Н	NH-nC <sub>11</sub> H <sub>23</sub>	Cl	СНО	Ö1
	450	н	NH-nC <sub>1 2</sub> H <sub>25</sub>	Cl	СНО	öι
	451	н	NH-nC <sub>13</sub> H <sub>27</sub>	Cl	СНО	ÖΊ
	452	н	NH-nC <sub>14</sub> H <sub>29</sub>	Cl	СНО	Ö1

EP 0 447 891 A1

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	453	Н	NH-nC <sub>15</sub> H <sub>31</sub>	Cl	СНО	öl
٠	454	н	NH-nC <sub>16</sub> H <sub>33</sub>	C1	СНО	öl
	455	Н	NH-nC <sub>17</sub> H <sub>35</sub>	Cl	СНО	Ö1
10	456	Н	NH-nC <sub>18</sub> H <sub>37</sub>	C1	СНО	öl
	457	Н	NH-nC <sub>19</sub> H <sub>39</sub>	Cl	СНО	öl
	458	Н	NH-nC 20H41	Cl	СНО	Ö1
	459	Н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	СНО	Öl
15	460	Н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	СНО	Ö1
	461	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	cı	СНО	
	462	н	NH-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	cı	СНО	
20	463	Н	NH-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	cı	СНО	
20	464	Н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	СНО	
	465	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	СНО	
	466	Н	NH-CH <sub>2</sub> -COOH	Cl	СНО	
25	467	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COOH	C1	СНО	
	468	Н	NH(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> COOH	Cl	СНО	
	469	Н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> - CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	СНО	öl
30	470	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OH	Cl	СНО	
•	471	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OH	Cl	CHO	
	472	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Thiomorpholino-S,S-dioxid	Cl	Н	
	473	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	Cl	СНО	
35	474	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	СНО	
	475	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>3</sub>	Cl	СНО	
	476	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	СНО	
	477	н	NH-Cyclopropyl	Cl	СНО	
40	478	Н	NH-Cyclopentyl	Cl	СНО	
	479	н	NH-Cyclohexyl	Cl	СНО	
	480	н	NH-Cycloheptyl	Cl	CHO	
	481	н	NH-Cyclooctyl	C1	СНО	
45	482	н	NH-Cyclododecyl	cı	СНО	

Tabelle 1 (F rtsetzung)

$\begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	hmelz- nkt (°C)
$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	
485 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-TiC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> C1 H 486 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-TiSoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> C1 H 487 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-TiSoC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> C1 H 91 488 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-TiSoC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> C1 H 489 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-SecC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> C1 H 490 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-tertC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> C1 H	
487 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> Cl H 91  488 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-isoC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> Cl H  489 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-secC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> Cl H  490 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-tertC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> Cl H	
$\begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	
489 $C_{6}H_{5}$ NH-sec $C_{4}H_{9}$ Cl H 490 $C_{6}H_{5}$ NH-tert $C_{4}H_{9}$ Cl H	7-98
490 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-tertC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> Cl H	
, s	
401 0 H H = 0 H	
	8-70
<sup>20</sup> 492 С <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH—NeoC <sub>5</sub> H <sub>11</sub> С1 н	
493 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH—nC <sub>6</sub> H <sub>13</sub> C1 H	
494 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-nC <sub>7</sub> H <sub>15</sub> Cl H	
25 495 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH—nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub> Cl H	
496 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH—nC <sub>9</sub> H <sub>19</sub> Cl H	
497 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH—nC <sub>10</sub> H <sub>21</sub> Cl H Ö	1
498 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-nC <sub>11</sub> H <sub>23</sub> Cl H Ö1	1
499 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-nC <sub>1 2</sub> H <sub>25</sub> Cl H ö	ı
500 $C_6H_5$ NH-n $C_{13}H_{27}$ Cl H ö	1
501 $C_6H_5$ NH-n $C_{14}H_{29}$ Cl H ö	1
35 502 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-nC <sub>15</sub> H <sub>31</sub> Cl H Öl	1
503 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH—nC <sub>16</sub> H <sub>33</sub> C1 H Ö	1
504 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-nC <sub>17</sub> H <sub>35</sub> Cl H Ö	ı
505 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-nC <sub>18</sub> H <sub>37</sub> Cl H Ö	ı
506 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-nC <sub>19</sub> H <sub>39</sub> Cl H ö	1
507 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH—nC <sub>20</sub> H <sub>41</sub> Cl H ö	1
508 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> C1 H Ö	1
45 509 C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> NH-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> Cl H Ö	1

50

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	510	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	
	511	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	
	512	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	cı	Н	
10	513	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	
	514	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	
	515	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-CH 2-COOH	Cl	Н	
15	516	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -COOH	cı	н	
15	517	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -COOH	Cl	н	
	518	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> - CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C1	Н	öl
	519	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OH	C1	Н	
20	520	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OH	Cl	Н	
	521	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	Cl	Н	
	522	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	
25	523	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>3</sub>	Cl	Н	
23	524	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C1	H	
	525	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-Cyclopropy1	C1	H	
	526	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-Cyclopentyl	Cl	H	
30	527	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH—Cyclohexyl	C1	Н	
	528	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-Cycloheptyl	C1	Н	
	529	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-Cyclooctyl	C1	Н	
	530	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-Cyclododecyl	cı	Н	
35	531	н	NH-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	cı	СНО	
	532	Н	NH-CH <sub>Z</sub> -C≡CH	C1	СНО	
	533	н	NH-Methallyl	Cl	СНО	
	534	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	Cl	н	
40	535	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH—CH <sub>2</sub> —C≡CH	cı	н	
	536	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	N <del>H M</del> ethallyl	Cl	Н	
	537	н	NH-CH <sub>3</sub>	cı	C00C 2H5	
45	538	н	NH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	COOC 2H5	

50

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	539	н	NH-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	COOC 2H5	
	540	Н	NH—i soC 3H7	Cl	C00C 2H5	
10	541	н	NH—nC4H9	Cl	C00C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
,,	542	Н	NH-i soC4Hg	Cl	C00C 2H5	
	543	Н	NH-secC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CI	C00C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	544	н	NH-tertC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	C00C 2H5	
15	545	н	NH-nC5H <sub>11</sub>	cı	C00C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	546	н	NH-NeoC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	cı	C00C 2H5	
	547	н	NH-nC6H13	C1	C00C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	548	н	NH-nC7H15	cı	C00C 2H5	
20	549	Н	NH-nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	C1	C00C 2H5	
	550	Н	NH-nCgH <sub>1</sub> g	Cl	C00C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	551	Н	NH-nC <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	Cl	COOC 2H5	öι
	552	Н	NH-nC <sub>11</sub> H <sub>23</sub>	C1	COOC 2H5	öl
25	553	Н	NH-nC <sub>12</sub> H <sub>25</sub>	C1	COOC 2H5	Ö1
	554	н	NH-nC <sub>13</sub> H <sub>27</sub>	C1	C00C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	öl
	555	н	NH-nC <sub>14</sub> H <sub>29</sub>	Cl	C00C 2H5	öl
30	556	н	NH-nC <sub>15</sub> H <sub>31</sub>	Cl	C00C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	öl
<b>55</b>	557	н .	NH-nC <sub>16</sub> H <sub>33</sub>	Cl	COOC 2H5	öl
	558	Н	NH—nC <sub>17</sub> H <sub>35</sub>	C1	C00C 2H5	Ö1
	<b>559</b>	н	NH—nC <sub>18</sub> H <sub>37</sub>	Cl	C00C 2H5	öl
35	560	Н	NH-nC <sub>19</sub> H <sub>39</sub>	Cl	COOC 2H5	öl
	561	н	NH-nC <sub>20</sub> H <sub>41</sub>	Cl	COOC 2H5	Öl
	562	н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Ö1
	563	н	$NH-CH(CH_3)-(CH_2)_3CH_3$	C1	COOC 2H5	Öl
40	564	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C1	C00C 2H5	
	565	н	NH-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	C00C 2H5	
	566	н	NH-CH2CH2C6H5	Cl	COOC 2H5	
	567	н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	C00C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
45						

. .--- .

50

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	568	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	COOC 2H5	
	569	Н	NH-CH <sub>2</sub> -COOH	Cl	COOC 2H5	
	570	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -COOH	Cl	COOC 2H5	
10	571	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -COOH	Cl	COOC 2H5	
	572	н	NH—CH(CH <sub>3</sub> )—(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	COOC 2H5	Öl
	573	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OH	Cl	COOC 2H5	
15	574	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OH	Cl	COOC 2H5	
	575	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	Cl	COOC 2H5	
	576	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	COOC 2H5	
	577	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>3</sub>	Cl	COOC 2H5	
20	578	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	COOC 2H5	
	579	H,	NH-Cyclopropyl	Cl	COOC 2H5	
	580	Н	NH—Cyclopentyl	Cl	COOC 2H5	
	581	н	NH-Cyclohexyl	Cl	COOC 2H5	
25	582	Н	NH—Cycloheptyl	Cl	COOC 2H5	
	583	н	NH-Cyclooctyl	Cl	COOC 2H5	
	584	Н	NH-Cyclododecyl	Cl	C00C 2H5	
30	585	Н	NH-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	C1	C00C 2H5	
	586	H	NH-CH 2-C≡CH	Cl	C00C 2H5	
	587	н	NH-Methallyl	Cl	C00C 2H5	
	588	н	NH-CH <sub>3</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
35	589	н	NH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	590	н	NH-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	591	н	NH-isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	592	Н	NH-nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
40	593	Н	NH—isoC4H9	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	594	н	NH-secC4H9	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	595	н	NH—tertC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
45	596	<b>H</b> :	NH-nC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	

50

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	597	н	NH-NeoC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	598	н	NH-nC <sub>6</sub> H <sub>1 3</sub>	cı	CONH <sub>2</sub>	
10	599	H <sup>r</sup>	NH-nC7H15	Сl	CONH <sub>2</sub>	
	600	н	NH-nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	cı	CONH <sub>2</sub>	
	601	н	NH-nC <sub>9</sub> H <sub>1</sub> <sub>9</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	602	Н	NH-nC <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	C1	CONH <sub>2</sub>	
15	603	H	NH-nC <sub>11</sub> H <sub>23</sub>	C1	CONH <sub>2</sub>	öl
	604	н	NH-nC <sub>1 2</sub> H <sub>25</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	öl
	605	н	NH-nC <sub>1 3</sub> H <sub>27</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	öl
	606	н	NH-nC <sub>14</sub> H <sub>29</sub>	C1	CONH <sub>2</sub>	öl
20	607	н	NH-nC <sub>15</sub> H <sub>31</sub>	C1	CONH <sub>2</sub>	Öl
	608	Н	NH-nC <sub>16</sub> H <sub>33</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	öl
	609	Н	NH-nC <sub>17</sub> H <sub>35</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	öι
25	610	н	NH-nC <sub>18</sub> H <sub>37</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	öl
20	611	н	NH-nC <sub>19</sub> H <sub>39</sub>	<b>C1</b>	CONH <sub>2</sub>	öl
	612	Н	NH-nC 20H41	C1	CONH <sub>2</sub>	öl
	613	н	NH-CH(CH3)CH2CH2CH3	C1	CONH <sub>2</sub>	öl
30	614	Н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	C1	CONH <sub>2</sub>	öl
	615	Н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	616	н	NH-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	617	Н	NH-CH2CH2C6H5	Cl	CONH <sub>2</sub>	
35	618	н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	619	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	620	н	NH-CH <sub>2</sub> -COOH	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	621	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -COOH	Ç1	CONH <sub>2</sub>	
40	622	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -COOH	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	623	H	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> - CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	Öl
	624	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OH	C1	CONH <sub>2</sub>	
45	625	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OH	Cl	CONH <sub>2</sub>	

50

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	626	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	627	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	628	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>3</sub>	C1	CONH <sub>2</sub>	
10	629	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	cı	CONH <sub>2</sub>	
	630	Н	NH-Cyclopropyl	, <b>C1</b>	CONH <sub>2</sub>	
	631	н	NH-Cyclopenty1	cı	CONH <sub>2</sub>	
	632	н	NH_Cyclohexyl	Cl	CONH <sub>2</sub>	
15	633	н	NH-Cycloheptyl	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	634	H	NH—Cyclooctyl	C1	CONH <sub>2</sub>	•
	635	н	NH-Cyclododecyl	C1	CONH <sub>2</sub>	
20	636	н	NH-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	C1	CONH <sub>2</sub>	
	637	н	NH-CH 2-C≡CH	C1	CONH <sub>2</sub>	
	638	H -	NH-Methallyl	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	639	н	NH-CH <sub>3</sub>	Cl	COOC 2H5	
25	640	н	NH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C1	COOC 2H5	
	641	н	NH-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C1	C00C 2H5	
	642	н	NH—i soC 3H7	Cl	C00C 2H5	
	643	н	NH—nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	C00C 2H5	
30	644	Н	NH—i soC4Hg	Cl	C00C 2H5	
	645	н	NH—secC4Hg	Cl	C00C 2H5	
	646	н	NH-tertC <sub>4</sub> Hg	Cl	C00C 2H5	
05	647	н	NH-nC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	Cl	COOC 2H5	
35	648	н	NH—NeoC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	Cl	COOC 2H5	
	649	н	NH-nC <sub>6</sub> H <sub>1 3</sub>	Cl	COOC 2H5	
	<b>650</b>	н	NH-nC <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	Cl	COOC 2H5	
40	651	н	NH-nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	Cl	COOC 2H5	
	652	н	NH-nCgH <sub>1</sub> g	C1	COOC 2H5	
	653	н	NH-nC <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	C1	COOC 2H5	öl
	654	н	NH-nC <sub>11</sub> H <sub>23</sub>	Cl	COOC 2H5	Öl

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R2	Rest R3	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	655	Н	NH-nC <sub>12</sub> H <sub>25</sub>	Cl	C00C 2H5	Öl
	656	н	NH-nC <sub>13</sub> H <sub>27</sub>	Cl	COOC 2H5	öι
	657	н	NH-nC <sub>14</sub> H <sub>29</sub>	Сl	COOC 2H5	öι
10	658	н	NH-nC <sub>15</sub> H <sub>31</sub>	Cl	COOC 2H5	öl
	659	н	NH-nC <sub>16</sub> H <sub>33</sub>	cı	COOC 2H5	Öl
	660	н	NH-nC <sub>17</sub> H <sub>35</sub>	C1	COOC 2H5	Öl
15	661	н	NH-nC <sub>18</sub> H <sub>37</sub>	cı	COOC 2H5	Öl .
13	662	н	NH-nC <sub>19</sub> H <sub>39</sub>	Cl	COOC 2H5	Ö1
	663	н	NH-nC <sub>20</sub> H <sub>41</sub>	Cl	COOC 2H5	Öl
	664	н	NH-CH(CH3)CH2CH2CH3	Cl	COOC 2H5	ÖΊ
20	665	н	NH-CH(CH3)-(CH2)3CH3	C1	COOC 2H5	öl
	666	Н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C1	COOC 2H5	
	667	н	NH-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C1	C00C 2H5	
	668	н	NH-CH 2CH 2C6H5	C1	C00C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
25	669	Н	NH-CH(CH3)-C6H5	C1	COOC 2H5	
	670	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	cı	COOC 2H5	
	671	н	NH-CH 2-COOH	Cl	C00C 2H5	
	672	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -COOH	Cl	C00C 2H5	
30	673	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -COOH	Cl	C00C 2H5	
	674	Н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	C00C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Öl
	675	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OH	Cl	C00C 2H5	
35	676	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OH	C1	COOC 2H5	
	677	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	Cl	COOC 2H5	
	678	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	C00C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	679	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>3</sub>	Cl	COOC 2H5	
40	680	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	C00C 2H5	
	681	Н	NH—Cyclopropyl	Cl	C00C 2H5	
	682	н	NH—Cyclopentyl	Cl	C00C 2H5	
45	683	н	NH-Cyclohexyl	Cl	C00C 2H5	

50

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R <sup>1</sup>	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R <sup>4</sup>	Schmelz- punkt (°C)
	684	н	NH-Cycloheptyl	Cl	COOC 2H5	
	685	Н	NH-Cyclooctyl	Cl	COOC 2H5	
10	686	н	NH—Cyclododecyl	Cl	COOC 2H5	
	687	н	NH-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	Cl	COOC 2H5	
	688	н	NH-CH 2-C≡CH	Cl	COOC 2H5	
	689	н	NH-Methallyl	C1	COOC 2H5	
15	690	н	NH-CH <sub>3</sub>	Cl	COOCH 3	
	691	н	NH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	cı	COOCH <sub>3</sub>	
	692	Н	NH-nC 3H7	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	693	Н	NH—i soC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
20	694	H	NH-nC4Hg	Cl	COOCH 3	
	695	н	NH—isoC4Hg	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	696	H	NH-secC4H9	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	697	Н	NH-tertC4G9	Cl	COOCH 3	
25	698	H	NH-nC5H11	cı	COOCH <sub>3</sub>	
	699	н	NH—NeoC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	700	Н	NH-nC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	C1	COOCH <sub>3</sub>	
30	701	н	NH-nC7H15	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
50	702	H	NH-nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	C1	COOCH <sub>3</sub>	
	703	н	NH-nCgH <sub>1</sub> g	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	704	н	NH-nC <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	C1	COOCH <sub>3</sub>	öι
35	705	н	NH-nC <sub>11</sub> H <sub>23</sub>	Cl	COOCH 3	öl
	706	н	NH-nC <sub>12</sub> H <sub>25</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	öι
	707	Н	NH-nC <sub>1 3</sub> H <sub>27</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	öι
	708	H	NH-nC <sub>14</sub> H <sub>29</sub>	Cl	COOCH 3	öl
40	709	Н	NH-nC <sub>15</sub> H <sub>31</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	öl
	710	Н	NH-nC <sub>16</sub> H <sub>33</sub>	C1	COOCH <sub>3</sub>	öl
	711	Н	NH-nC <sub>17</sub> H <sub>35</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	öl
	712	Н	NH-nC <sub>18</sub> H <sub>37</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	Öl
45	713	Н	NH-nC <sub>19</sub> H <sub>39</sub>	Cl	COOCH 3	öl

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	714	Н	NH-nC <sub>20</sub> H <sub>41</sub>	Cl	соосн3	Ö1
	715	н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	cı	COOCH3	ö١
10	716	Н	$NH-CH(CH_3)-(CH_2)_3CH_3$	Cl	COOCH 3	öl
	717	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	COOCH 3	
	718	н	NH-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	COOCH 3	
	719	Н	NH-CH2CH2C6H5	Cl	COOCH 3	
15	720	Н	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	721	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	722	н	NH-CH <sub>2</sub> -COOH	Cl .	COOCH 3	
	723	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -COOH	Cl	COOCH 3	
20	724	H	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -COOH	cı	COOCH <sub>3</sub>	
	725	Н	NH-(CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> - CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cı	COOCH <sub>3</sub>	öl
	726	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OH	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
25	727	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OH	cı	COOCH <sub>3</sub>	
	728	н .	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	CI	COOCH <sub>3</sub>	
	729	H	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C1	COOCH <sub>3</sub>	
00	730	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>3</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
3 <b>0</b>	731	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>5</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	732	н	NH—Cyclopropyl	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	733	Н	NH—Cyclopentyl	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
35	734	н	NH-Cyclohexyl	C1	COOCH <sub>3</sub>	
	735	н	NH-Cycloheptyl	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	736	н	NH-Cyclooctyl	C1	COOCH 3	
	737	H	NH-Cyclododecyl	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
40	738	н	NH-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	739	н	NH—CH2—C≡CH2	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	740	H	N <del>H M</del> ethallyl	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	741	Н	NH-nC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	Cl	СООН	
45	742	Н	NH-nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	cı	соон	
	743	н	NH-nC <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	Cl	СООН	

EP 0 447 891 A1

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R <sup>1</sup>	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	744	CH <sub>3</sub>	NH-nC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	Cl	СНО	
	745	CH <sub>3</sub>	NH-nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	Cl	СНО	
	746	СН3	NH-nC <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	Cl	СНО	
10	747	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-nC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	Cl	СНО	
	748	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	Cl	СНО	
	749	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-nC <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	Cl	СНО	
4.5	750	CH <sub>2</sub> Cl <sub>2</sub>	Cl .	Cl	Н	97-99
15	751	н	CH(CH3)-(CH2)4CH3	Cl	СНО	öl
	752	Н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-CH <sub>3</sub>	Cl	СНО	
	753	Н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	СНО	
20	754	Н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-CF <sub>3</sub>	cı	СНО	
	755	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	СНО	
	<b>756</b>	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	СНО	
	757	Н	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	СНО	
25	758	Н	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	СНО	
	759	Н	N(nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	СНО	
	760	н	N(nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	СНО	
	761	Н	N(CH2CH=CH2)2	Cl	СНО	
30	762	н	Pyrrolidino	Cl	СНО	
	763	н	Piperidino	Cl	СНО	
	764	Н	Hexamethylenimino	Cl	СНО	
35	765	Н	Morpholino	Cl	СНО	
33	766	н	N(CH2CH2OCH3)2	cı	СНО	öl
	767	н	S-CH <sub>3</sub>	Cl	СНО	
	768	н	S-C 2H5	Cl	СНО	
40	769	Н	S-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	cı ·	СНО	
	770	н	S-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>3</sub>	Cl	СНО	
	771	н	SCN	Cl	СНО	
	772	н	0-CH <sub>3</sub>	Cl	CHO	
45	773	Н	0-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	СНО	
	774	н	O-nC 3H7	Cl	СНО	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R³	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	775	Н	O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	СНО	
	776	н	о-сн <sub>2</sub> сн(сн <sub>3</sub> )осн <sub>3</sub>	cı	СНО	
	777	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH3)-(CH2)4CH3	C1	Н	Öl
10	778	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-C6H4-(2)-CH3	C1	Н	
	779	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-C6H4-(2)-C2H5	C1	Н	
	780	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-CF <sub>3</sub>	cı	Н	
.15	781	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	cı	Н	
.13	782	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C1	н	
	783	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	н	
	784	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	C1	Н	
20	785	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	н	
	786	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	N(nC4H9) 2	C1	н	
	787	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	N(CH2CH=CH2)2	C1	н	
	788	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Pyrrolidino	cı	н	
25	789	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Piperidino	cı	н	
	790	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Hexamethylenimino	C1	Н	
	791	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Morpholino	C1	н	
	792	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	N(CH2CH2OCH3)2	C1	н	
30	793	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	S-CH <sub>3</sub>	C1	н	
	794	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	S-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C1	н	
	795	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	S-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	н	
35	796	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	S-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>3</sub>	Cl	н	
	797	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	SCN	C1	Н	
	798	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	0-СН3	Cl	н	
	79 <del>9</del>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	0-C 2H5	· cı	н	
40	800	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	0-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C1	Н	
	801	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	н	
	802	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	O-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub>	Cl	Н	
	803	н	NH-CH(CH3)-(CH2)4CH3	Cl	CONH <sub>2</sub>	Öl
45	804	Н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-CH <sub>3</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	

50

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	805	н	NH-C6H4-(2)-C2H5	Cl	CONH <sub>2</sub>	-
	806	Н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-CF <sub>3</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
10	807	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -isoC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
70	808	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	809	н	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	CONH 2	
	810	Н	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	•
15	811	н	N(nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>	cı	CONH 2	
	812	н	N(nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> ) <sub>2</sub>	C1	CONH <sub>2</sub>	
	813	н	N(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	C1	CONH 2	
	814	Н	Pyrrolidino	Cl	CONH <sub>2</sub>	
20	815	н	Piperidino	cı	CONH 2	
	816	Н	Hexamethylenimino	cı	CONH <sub>2</sub>	
	817	н	Morpholino	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	818	н	N(CH2CH2OCH3)2	cı	CONH 2	
25	819	н	S-CH <sub>3</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	820	н	S-C 2H5	C1	CONH <sub>2</sub>	
	821	н	S-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
30	822	H -	S-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>3</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
30	823	н	SCN	c1	CONH <sub>2</sub>	
	824	н	0-CH <sub>3</sub>	Cl	CONH <sub>2</sub>	
	825	н	0C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C1	CONH <sub>2</sub>	
35	826	Н	0-nC 3H7	cı	CONH <sub>2</sub>	
	827	Н	O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	cı	CONH <sub>2</sub>	
	828	н	O-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub>	C1	CONH <sub>2</sub>	
	829	H	CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	СООН	öι
40	830	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-CH <sub>3</sub>	cı	COOH	
	831	н	NH-C6H4-(2)-C2H5	Cl	СООН	
	832	н	$NH-C_6H_4-(2)-CF_3$	C1	СООН	
	833	Н	NH-(CH2)3-isoC3H7	Cl	СООН	
45	834	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	СООН	

EP 0 447 891 A1

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R <sup>4</sup>	Schmelz- punkt (°C)
	835	н	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	СООН	
	836	н	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	СООН	
10	837	н	N(nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	СООН	
,0	838	н	N(nC4H <sub>9</sub> ) <sub>2</sub>	c1	соон	
	839	н	N(CH2CH=CH2)2	C1	соон	
	840	н	Pyrrolidino	Cl	соон	
15	841	н	Piperidino	Cl	СООН	
	842	н	<b>Hexamethy lenimino</b>	C1	СООН	
	843	н	Morpholino	Cl	СООН	
	844	н	N(CH2CH2OCH3)2	Cl	СООН	
20	845	н	S-CH <sub>3</sub>	cı	СООН	
	846	н	S-C 2H5	C1	СООН	
	847	н	S-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	СООН	
	848	Н	S-CH2-CH=CH3	cı	СООН	
25	849	н	SCN	Cl	СООН	
	850	н	0-CH <sub>3</sub>	C1	СООН	
	851	н	0-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	СООН	
30	852	н	0-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	COOH	
00	853	н	O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	СООН	
	854	н	0—CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )0CH <sub>3</sub>	Cl	СООН	
	855	н	CH(CH <sub>3</sub> )-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
35	856	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> (2)-CH <sub>3</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	857	Н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C1	COOCH <sub>3</sub>	•
	858	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-CF <sub>3</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	85 <del>9</del>	Н	$NH-(CH_2)_3-isoC_3H_7$	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
40	860	н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	861	Н	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	·
	862	Н	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	863	H	N(nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
45	864	н	N(nC4H <sub>9</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	C00CH3	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R <sup>4</sup>	Schmelz- punkt (°C)
	865	н	N(CH2CH=CH2)2	Cl	соосн3	
	866	н	Pyrrolidino	C1	COOCH <sub>3</sub>	
40	867	н	Piperidino	C1	COOCH <sub>3</sub>	
10	868	н	<b>Hexamethylenimino</b>	cı	C00CH <sub>3</sub>	
	869	н	Morpholino	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	870	н	N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	cı	C00CH3	
15	871	н	S-CH <sub>3</sub>	cı	COOCH <sub>3</sub>	
	872	н	S-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	C00CH <sub>3</sub>	
	873	н	S-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	874	н	S-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>3</sub>	C1	COOCH <sub>3</sub>	
20	875	н	SCN	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	876	н	O-CH <sub>3</sub>	Cl	COOCH <sub>3</sub>	
	877	н	CH(CH3)-(CH2)4CH3	C1	COOC 2H5	öl
	878	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-CH <sub>3</sub>	C1	COOC 2H5	
25	879	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	COOC 2H5	
	880	н	NH-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -(2)-CF <sub>3</sub>	Cl	COOC 2H5	
	881	Н	$NH-(CH_2)_3-isoC_3H_7$	Cl	COOC 2H5	
30	882	Н	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	COOC 2H5	
30	883	н	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	COOC 2H5	
	884	н	N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	COOC 2H5	
	885	н	N(nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	COOC 2H5	
35	886	н	N(nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> )2	cı	C00C 2H5	
	887	н	N(CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	Cl .	COOC 2H5	
	888	Н	Pyrrolidino	Cl	COOC 2H5	
	889	н	Piperidino	Cl	COOC 2H5	
40	890	Н	Hexamethylenimino	C1	COOC 2H5	
	891	Н	Morpholino	Cl	COOC 2H5	
	892	Н	N(CH2CH2OCH3)2	cl	COOC 2H5	·
	893	Н	S-CH <sub>3</sub>	cı	COOC 2H5	
45	894	Н	S-C 2H5	C1	COOC 2H5	

50

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R <sup>1</sup>	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R <sup>4</sup>	Schmelz- punkt (°C)
	895	н	S-nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CI	COOC 2H5	
	896	Н	S-CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>3</sub>	Cl	COOC 2H5	
	897	Н	SCN	Cl	COOC 2H5	
10	898	Н	0-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	COOC 2H5	
	899	H	O—nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	COOnC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
	900	н	O—nC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	COOnC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
	901	н	0-nC5H11	Cl	COOnC <sub>5</sub> H <sub>1</sub>	ı
15	902	Н	0—nC <sub>6</sub> H <sub>1 3</sub>	Cl	COOnC <sub>6</sub> H <sub>1</sub>	3
	903	н	cı	Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	262-266
	904	CH <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	Cl	н	
20	905	CH <sub>3</sub>	NH-nC4Hg	Cl	Н	37-40
	906	CH <sub>3</sub>	NH-isoC4H9	Cl	Н	
	907	СН3	NH—tertC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>			
	908	CH <sub>3</sub>	NH—isoC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	C1	Н	
25	909	CH <sub>3</sub>	NH-NeoC <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	cı	Н	
	910	CH <sub>3</sub>	NH-nC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	Cl	Н	59-60
	911	CH <sub>3</sub>	NH-nC <sub>7</sub> H <sub>15</sub>	Cl	Н	
	912	CH <sub>3</sub>	NH-nC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	Cl	Н	
30	913	CH <sub>3</sub>	NH-nCgH <sub>1</sub> g	Cl	Н	öl
	914	CH <sub>3</sub>	NH-nC <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	Cl	н	öl
	915	CH <sub>3</sub>	NH-nC <sub>11</sub> H <sub>23</sub>	Cl	Н	öl
35	916	CH <sub>3</sub>	NH-nC <sub>12</sub> H <sub>25</sub>	C1	Н	ö1
33	917	CH <sub>3</sub>	NH-nC <sub>1 3</sub> H <sub>27</sub>	Cl	H	öι
	918	CH <sub>3</sub>	NH-nC <sub>14</sub> H <sub>29</sub>	Cl	н	öl
	919	CH <sub>3</sub>	NH-nC <sub>15</sub> H <sub>31</sub>	Cl	Н	Öl
40	920	CH <sub>3</sub>	NH-nC <sub>16</sub> H <sub>33</sub>	Cl	н	Öl
	921	CH <sub>3</sub>	NH—nC <sub>17</sub> H <sub>35</sub>	Cl	н	öl
	922	CH <sub>3</sub>	NH-nC <sub>18</sub> H <sub>37</sub>	Cl	Н	Ö1
	923	CH <sub>3</sub>	NH—nC <sub>19</sub> H <sub>39</sub>	C1	н	öl

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
·	924	CH <sub>3</sub>	NH-nC 20H41	cı	Н	öl
	925	CH <sub>3</sub>	NH-CH(CH3)CH2CH2CH3	_ C1	Н	Ö1
10	926	CH <sub>3</sub>	NH-CH(CH <sub>3</sub> ) -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	н	ö1
	927	CH <sub>3</sub>	NH-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	н	
	928	CH <sub>3</sub>	NH-CH 2CH 2C6H5	C1	н	
	929	CH <sub>3</sub>	NH-CH(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	
15	930	CH <sub>3</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Н	•
	931	CH <sub>3</sub>	NH-CH <sub>2</sub> -COOH	Cl	н	
	932	CH <sub>3</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -COOH	Cl	н	
	933	CH <sub>3</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -COOH	Cl	Н	
20	934	СН3	NH-CH(CH3)- -(CH2)3-CH(CH3)2	Cl	Н	
	935	CH <sub>3</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OH	C1	Н	
	936	CH <sub>3</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	Cl	Н	
25	937	CH <sub>3</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C1	Н	
	938	CH <sub>3</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OCH <sub>3</sub>	Cl	Н	
	939	CH <sub>3</sub>	NH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C1	н	
	940	CH <sub>3</sub>	NH-Cyclopropyl	C1	Н	
30	941	CH <sub>3</sub>	NH-Cyclobutyl	Cl	H	
	942	CH <sub>3</sub>	NH-Cyclopentyl	C1	н	
	943	CH <sub>3</sub>	NH-Cycloheptyl	Cl	н	
	944	CH <sub>3</sub>	NH-Cyclooctyl	Cl	Н	
35	945	CH <sub>3</sub>	NH-Cyclononyl	C1	Н	
	946	CH <sub>3</sub>	NH-Cyclodecyl	Cl	Н	•
	947	CH <sub>3</sub>	NH-Cyclododecyl	C1	Н	
40	948	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>Z</sub>	C1	Н	
	949	CH <sub>3</sub>	N(nC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>	c1	Н	
	950	CH <sub>3</sub>	Pyrrolidino	C1	н	
	951	CH <sub>3</sub>	Piperidino	Cl	Н	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

50	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R <sup>2</sup>	٠.	Rest R <sup>3</sup>	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
	952	CH <sub>3</sub>	Hexamethylenimino		Cl	Н	
55	953	CH <sub>3</sub>	M rpholino		Cl	Н	
•••	954	CH <sub>3</sub>	Thiomorph lino		Cl	Н	
	955	CH <sub>3</sub>	Thiomorpholino-S,S-dioxid		Cl	н	

#### Anwendungsbeispiele

Die folgenden Beispiele zeigen die insektizide Wirkung der V rbindung n I.

#### 5 Beispiel Nr. 956

Deckel und Boden einer Petrischale wurden mit insgesamt 1 ml einer 0,1 gew.-%igen acetonischen Lösung der Wirkstoffe gleichmäßig ausgekleidet. Nach dem Verdunsten des Lösungsmittels brachte man je 10 Fliegen der Gattung Musca Domestica (Stubenfliege) und Wasserwatte in die Schalen ein. Anschließend wurden die Schalen geschlossen. Nach 24 Stunden wurde die Mortalität der Verbindungen durch Abzählen der gestorbenen Fliegen ermittelt.

Tabelle 2

15 ·	Synthese-Bsp. Nr.	Mortalität [%]
	12	100
20	147	100
	157	80
	155	80
	156	100
	168	100
25	395	100

#### Beispiel 957

30

35

Getopfte Buschbohnen, die das zweite Folgeblattpaar zeigten, einen starken Milbenbefall (Tetranychus telarius, Rote Spinne (A)) und eine reichliche Eiablage aufwiesen, wurden mit 50 ml wäßriger Wirkstofflösung gleichmäßig besprüht. Nach 5 Tagen wurde die Mortalität der Wirkstoffe mittels eines Mikroskops bestimmt. Die Pflanzen standen in dieser Zeit unter üblichen Gewächshausbedingungen.

Tabelle 3

	Synthese-Bsp. Nr.	Substanzkonz. [ppm]	Mortalität [%]
40	155	1000	ca. 90
	156	≤ 1000	100
	157	≤ 1000	100
45	395	≤ 1000	100

#### Beispiel 958

Junge Bohnenpflanzen (vicia faba) mit einer starken Kolonie der schwarzen Laus (Aphis fabae) wurden mit je 50 ml einer wäßrigen Lösung des Wirkstoffs gleichmäßig besprüht. Nach 24 Stunden wurde die Mortalität der Wirkstoffe bestimmt.

Tabelle 4

5	Synthese-Bsp. Nr.	Substanzkonz. [ppm]	Mortalität [%]
	154	≤ 1000	100
	155	1000	100
	156	1000	100
10	185	1000	100
	395	1000	100

#### 15 Beispiel 959

Auf die Oberfläche eines Nährbodens (5 ml in Kunststoffpetrischälchen, Durchmesser 25 mm, Höhe 10 mm) wurden 0,5 ml einer acetonischen Wirkstofflösung gegeben. Nach dem Verdunsten des Acetons wurde der Nährboden mit 30 µl E.-Coli-Bakterien und 50 µl Nematodensuspension (Caenorhabditis elegans) infiziert. Nach 2,8 Stunden wurde die Kontaktwirkung in % Mortalität ermittelt.

Tabelle 5

25	Synthese-Bsp. Nr.	Substanzkonz. [ppm]	Mortalität [%]
	147	100	100
	154	4	80
30	155	4	80
	156	10	100
	157	10	100
	168	100	100
35	275	100	100
	282	10	100
	293	100	100
	395	100	100
40			

### Beispiel 960

Je 5 junge Zecken (Ornithodorus monbata) wurden in einem wasserdurchlässigen Beutel für 5 sec in eine wäßrige Wirkstoffaufbereitung getaucht. Danach wurden die Beutel für 48 Std. frei aufgehängt und anschließend wurde die Mortalität der Wirkstoffe bestimmt.

	Synthese-Beispiel Nr.	Substanzkonz. [ppm]	Mortalität [%]
50	147	400	100
	154	40	100
	155	1000	100
	156	400	80
55	157	1000	100
	168	20	80

#### Beispiel 961

Zum Test auf herbizid Wirkungen wurden Sam n v rschiedener Pflanzen in Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand und 3,0 Gew.-% Humus nach Arten getrennt eingepflanzt. Die Pflanzen wurden bis zu einer Größ von 3 bis 15 cm angezogen und dann iner Nachauflaufbehandlung mit den in Wasser suspendierten Wirkstoffen unterzogen. Die Aufwandmenge betrug 2,0 kg/ha Wirkstoff.

Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzen sich aus folgenden Arten zusammen:

10	Abkürzung Amare	Lateinischer Name Amaranthus retroflexus	Deutscher Name Zurückgekrümmter	Englischer Name redroot pigweed
			Fuchsschwanz	
	GALAP	Galium aparine	Klettenlabkraut	catchweed
				bedstraw .
15	LAMAM	Lamium amplexicaule	stengelumfassende	henbit
			Taubnessel	

Die Versuchsergebnisse wurden nach einer Skala von 0 bis 100 bewertet, wobei 100 bedeutet, daß die 20 Pflanzen völlig zerstört sind und 0 bedeutet das ein normaler Wachstumsverlauf beobachtbar war.

	Synthese-Bsp. Nr.	Testpfla	nzen und	Schädigung
		AMARE	GALAP	LAMAM
25	144	100	100	90
	146	100	90	70

#### 30 Patentansprüche

45

50

55

1. Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate der allgemeinen Formel I

in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

R1 Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Chloralkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyl

R<sup>2</sup> Fluor, Chlor, Brom, Jod, Hydroxy, Azido, Cyano, Thiocyanato, Mercapto, ein nicht über Stickstoff gebundener organischer Rest oder ein Rest NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, worin R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino oder organische Reste bedeuten oder gemeinsam mit dem Stickstoffatom einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 8 Ringatomen bilden, mit der Maßgabe, daß R<sup>2</sup> nicht Phenoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-alkylamino bedeutet,

R³ Chlor, Brom, Hydroxy oder Mercapto mit der Maßgabe, daß nicht gleichzeitig R² Hydroxy und R³ Brom bedeutet und daß nicht gleichzeitig R³ Hydroxy und R⁴ Alkoxycarbonyl oder Carboxy bedeutet,

R<sup>4</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Mono-, Di- oder Trihalogenalkyl, Phenyl, Cyano, Formyl, Hydroxyiminomethyl, Carboxy, Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl oder einen Rest der Formel

CH=X

worin X der über Stickstoff gebunden Rest eines primären Amins oder der über Kohlenstoff gebundene Rest iner methyl naktiven Verbindung ist, sowie die Tautomeren dieser Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate und die nutzpflanzenverträglich n Salze dieser Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate und ihrer Tautomer n.

2. Verfahren zur Herstellung von Thieno[2,3-d]pyrimidinderivaten der allgemeinen Formel I nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der allgemeinen Formel II

in der R³ und R⁴ die angegebene Bedeutung haben, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel III

$$\begin{array}{c}
0 \\
 \searrow -N \\
 \searrow -N \\
 \searrow 73
\end{array}$$
(111)

5

15

30

35

40

50

55

in der R¹ die angegebene Bedeutung hat und T² sowie T³ unabhängig voneinander für C₁-C₄-Alkyl, Phenyl, oder zusammen mit dem Amidstickstoff für einen 5 bis 7 gliedrigen gesättigten Heterocyclus stehen, in Gegenwart von 1,1 bis 20 mol Phosphorylchlorid oder Phosphorylbromid, bezogen auf ein Mol II, zu Thieno[2,3-d]pyrimidinderivaten der allgemeinen Formel la

- in der R<sup>7</sup> für Chlor oder Brom steht, umsetzt und in diesen gegebenenfalls R<sup>7</sup> in an sich üblicher Weise gegen andere nucleophile Reste R<sup>2</sup> austauscht.
  - Verfahren zur Herstellung von Thieno[2,3-d]pyrimidinderivaten der allgemeinen Formel I nach Anspruch
     dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der allgemeinen Formel IV

$$\begin{array}{c|c}
R^3 & NH_2 \\
R^4 & S & NH_2
\end{array}$$
(1V)

in der die Substituenten R³ und R⁴ die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben, in an sich üblicher Weise mit einem Säureanhydrid, das mindestens einen Rest R¹-CO- enthält, oder einer Carbonsäure R¹-COOH, oder einem Addukt aus einer Carbonsäure R¹-COOH und einer Lewissäure, wobei R¹ jeweils die angegebene Bedeutung hat, zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ib

umsetzt, diese mit einem Phosphorylhalogenid in Verbindungen der allgemeinen Formel la gemäß Anspruch 2 überführt und in diesen gegebenenfalls R<sup>7</sup> in an sich üblicher Weise gegen andere nucleophile Reste R<sup>2</sup> austauscht.

 Verfahren zur Herstellung von Thieno[2,3-d]pyrimidinen der allgemeinen Formel I nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Thiophen der allgemeinen Formel II

in der R³ und R⁴ die angegeben Bedeutung haben, in an sich bekannter Weise mit Orthoestern der allgemeinen Formel V

 $^{5}$  (R80)  $_{3}C-R^{1}$  (V)

in der  $R^8$  für einen  $C_1\text{-}C_6\text{-}Alkylrest$  steht, zu Verbindungen der allgemeinen Formel VI

 $\begin{array}{c|c}
R^3 & CN & O-R^8 \\
R^4 & S & N & R^1
\end{array}$ 

- umsetzt und diese in an sich bekannter Weise in Gegenwart eines den Rest R<sup>2</sup> enthaltenden Nucleophils in die entsprechenden Verbindungen I überführt.
  - 5. Herbizide Mittel, enthaltend einen Trägerstoff und eine herbizid wirksame Menge eines Thieno[2,3-d]pyrimidinderivates der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1.
  - 6. Schädlingsbekämpfungsmittel, enthaltend einen Trägerstoff und eine wirksame Menge eines Thieno-[2,3-d]pyrimidinderivates der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1.
- 7. Wachstumsregulierende Mittel, enthaltend einen Trägerstoff und eine wachstumsregulierende Menge eines Thieno[2,3-d]pyrimidinderivates der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1.
  - Verwendung von Thieno[2,3-d]pyrimidinen der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von Schadpflanzen.
- Verwendung von Thieno[2,3-d]pyrimidinen der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von Schädlingen.
  - 10. Verwendung von Thieno[2,3-d]pyrimidinen der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 zur Regulation des Nutzpflanzenwachstums.

35

10

45

40

50

## **EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT**

	EINSCHLÄ	GIGE DOKUMENTE			EP 91103547.5
ategorie		ents mit Angabe, soweit erforderlich. Igeblichen Teile		Betriftt Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Ini. Ci.)
D,A	LTD)	54 090 MICAL INDUSTRIES e 1,10,11,2,6 *		1-10	C 07 D 495/04 A 01 N 49/90
D,A	<u>US - A - 4 19</u> (WEBBER) * Zusammen	<del></del>	:	1-10	
	·				
	·				
					RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (In) (3 9
					C 07 D 495/00
		·		-	
Der vor	liegende Recherchenbericht wu	rde für alle Patentansprüche erstellt.	_		·
	Recherchenort	Abschlußdatum der Recherch			Pruter
	WIEN	07-05-1991	-	ימ	
X : von be Y : von be ander A : techne D : nichts	GORIE DER GENANNTEN D esonderer Bedeutung allein esonderer Bedeutung in Verl en Veroffentlichung derselb ologischer Hintergrund ichriftliche Offenbarung henliteratur	OKUMENTEN E : álte nachtet nachtet nachtet nachtet nachten D : in central temper nachten between Kategorie L : aus	ch dem A der Anm s anderr	entdokumo Anmeldeda Jeldung and Gründen	RUS ent, das jedoch erst am oder tum veröflentlicht worden ist geführtes Dokument angeführtes Dokument Patentfamilie, überein-

EPA Form 1503 03 62

L8 ANSWER 16 OF 21 CAPLUS COPYRIGHT 2003 ACS

AN 1991:656224 CAPLUS

DN 115:256224

TI Preparation of thieno[2,3-d]pyrimidines as pesticides, herbicides, and plant growth regulators

IN Wiesenfeldt, Matthias; Etzbach, Karl Heinz; Hofmeister, Peter; Kuenast, Christoph; Westphalen, Karl Otto

PA BASF A.-G., Germany

SO Eur. Pat. Appl., 49 pp. CODEN: EPXXDW

DT Patent

LA German

FAN CNT 1

E WIA	. CN I	1												
	PATENT NO.			KIN	1D	DATE			API	PLICATION	ON NO.	DATE		
		4470	0.1			1	1001	0005		m n	1001 1	02547	1991030	10
PΙ	EP	4478	91		<b>A</b> 3	L	1991	0925		EP	1991-1	03547	1991030	00
	EP	4478	91		B1	L	19940427							
		R:	BE,	CH,	DE,	DK,	, ES,	FR,	GB,	IT,	LI, NL			
	DE	4008	726		A1	L	1991	0926		DE	1990-4	008726	1990031	19
	ES	2052	296		Т3	3	1994	0701		ES	1991-1	03547	1991030	80
	CA	2038	521		A.	A	1991	0920		CA	1991-2	038521	1991031	18
	JP	0421	7685		A2	2	1992	0807		JP	1991-5	2079	1991031	18
PRA	T DE	1990	-4008	3726			1990	0319						

J sound

OS MARPAT 115:256224

AB Title compds. I [R1 = H, C1-5 alkyl, C1-3 chloroalkyl, C3-6 cycloalkyl, Ph, CH2Ph; R2 = F, Cl, Br, iodo, OH, N3, NR5R6, etc.; R3 = Cl, Br, OH, SH; R4 = H, C1-6 alkyl, C3-6 haloalkyl, Ph, cyano, CHO, CO2H, etc.; R5, R6 = H, NH2, org. group or NR5R6 = 3-8 membered heterocyclyl; with provisos] were prepd. Thus 2-amino-3-cyano-4-oxo-4,5-dihydrothiophene was added to POCl3 at room temp. DMF was added dropwise and the soln. was stirred 1 h at room temp. and 2.5 h at 75.degree. to give title compd. I (R1, R4 = H; R2, R3 = Cl) in 94% yield. Over 300 I were prepd., with some tested as pesticides, herbicides, etc.

IT 137270-88-3P

RL: AGR (Agricultural use); BAC (Biological activity or effector, except adverse); BSU (Biological study, unclassified); SPN (Synthetic preparation); BIOL (Biological study); PREP (Preparation); USES (Uses) (prepn. of, as pesticide, herbicide, and plant growth regulator)

RN 137270-88-3 CAPLUS

CN Acetamide, N-[4-[(5-chlorothieno[2,3-d]pyrimidin-4-yl)amino]phenyl]- (9CI) (CA INDEX NAME)